(19) 世界知的所有権機関 国際事務局



(43) 国際公開日 2001 年10 月18 日 (18.10.2001)

PCT

(10) 国際公開番号 WO 01/77133 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07H 15/04, A61K 31/7028, A61P 29/00, 37/06, 31/04

(21) 国際出願番号: PCT/JP01/03005

(22) 国際出願日: 2001年4月6日(06.04.2001)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ: 特願2000-104700 2000年4月6日(06.04.2000) JF

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 三共株 式会社 (SANKYO COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒 103-8426 東京都中央区日本橋本町3丁目5番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ):渡辺由紀子

(WATANABE, Yukiko) [JP/JP]. 汐崎正生 (SHIOZAKI, Masao) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 大野彰夫, 外(OHNO, Akio et al.); 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AU, BR, CA, CN, CZ, HU, ID, IL, IN, KR, MX, NO, NZ, PL, RU, US, ZA.

(84) 指定国 (広域): ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR).

添付公開書類:

国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: 1-CARBOXYMETHYL ANALOGUES OF LIPID A

(54) 発明の名称: リピッドA1位カルボキシメチル類縁体

$$(HO)_{2}P-O'' \qquad O \qquad O \qquad (I)$$

$$(HO)_{2}P-O'' \qquad OR^{4} \qquad OR^{2}$$

(57) Abstract: Compounds represented by the general formula (I); and drugs (including anti-inflammatory drugs, drugs for autoimmune diseases, immunosuppressants, antiseptic drugs, and so on), containing the compounds as the active ingredient, wherein R^1 and R^3 are each C_{1-20} alkanoyl which may be substituted with one or more members selected from group A of substituents, or the like; R^2 and R^4 are each C_{1-20} alkyl which may be substituted with one or more members selected from group A of substituents, or the like; and R^5 is hydrogen, halogeno, hydroxyl, C_{1-6} alkoxy, or the like, group A of substituents consisting of halogeno, hydroxyl, oxo, C_{1-20} alkoxy, C_{1-20} alkanoyloxy and so on.

(57) 要約:

下記一般式(I)で表わされる化合物

「式中、R¹、R³は、下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換され

$$(HO)_{2}P-O'' OR^{4} OOR^{2}$$

$$(I)$$

$$(HO)_{2}P-O'' OR^{4}$$

$$(I)$$

ていてもよい C_1-C_{20} アルカノイル基等、 R^2 、 R^4 は、下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_1-C_{20} アルキル基、下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_1-C_{20} アルカノイル基等、 R^5 は、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、 C_1-C_6 アルコキシ基等、(置換基群A)は、ハロゲン原子、水酸基、オキソ基、 C_1-C_{20} アルコキシ基、 C_1-C_2 0アルカノイルオキシ基等]、及び、一般式(I1)で表される化合物を有効成分とする抗炎症剤、抗自己免疫疾患剤、免疫抑制剤又は抗敗血症剤等。

明 細 書

リピッドA1位カルボキシメチル類縁体

[関連する技術分野]

本発明は、優れたマクロファージ活性抑制作用を有し、抗炎症剤、抗自己免疫疾患剤、免疫抑制剤又は抗敗血症剤として有用な新規リピッドA類縁体に関する。

[背景技術]

腸内細菌から得られたグラム陰性菌の細胞壁の最表層には菌体外に分泌されない毒成分(内毒素)が含まれており、この内毒素は、内毒素活性以外にも、生体の自己防衛にかかわる免疫アジュバント活性作用、マクロファージ活性化作用、マイトジェン活性作用、発熱作用、腫瘍壊死作用、抗体産生増強作用、TNF誘導作用等の多様な生物活性を示す。

かかる内毒素はリポ多糖よりなり、いわゆるリピッドAと称される部分が内毒素活性の活性中心であることが確認されている(井本等、テトラヘドロン・レターズ, <u>26</u> 巻、1545(1985 年))。

また、リピッドA生合成前駆体として、モノサッカライドであるリピッドX及びリピッドYが、E.coli変異株より分離され、これらもリピッドAと同様の活性を示すことが明らかとなっている。

これらの結果から、上記の多様な活性のうち、有用な活性を有するリピッドA、X 又はYの誘導体合成の試みが頻繁に行われるようになり、例えば、特開平10-32 4694号又は特開平5-194470号に記載された誘導体が知られている。

「発明の開示〕

本発明者等の課題は、優れたマクロファージ活性抑制作用を有し、抗炎症剤、抗自己免疫疾患剤、免疫抑制剤又は抗敗血症剤として有用な新規リピッドA類縁体を見出すことである。

本発明者等は、上記課題を解決するため、鋭意努力した結果、1位にカルボキシメ

チレン基を有するリピッドA類縁体のある系統の化合物に、優れたマクロファージ活性抑制作用を見出し、本発明を完成した。

本発明の化合物は、

1)一般式

$$(HO)_{2}P-O'' OR^{4} OOH_{2}COOH$$

$$(I)$$

$$(I)$$

(式中、

 R^1 及び R^3 は、同一又は異なって、下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_1-C_{20} アルカノイル基、下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_3-C_{20} アルケノイル基又は下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_3-C_{20} アルキノイル基を示し、

 R^2 及び R^4 は、同一又は異なって、下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_1-C_{20} アルキル基、下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_2-C_{20} アルケニル基、下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_2-C_{20} アルキニル基、下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_1-C_{20} アルカノイル基、下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_3-C_{20} アルケノイル基又は下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_3-C_{20} アルキノイル基を示し、

 R^5 は、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、オキソ基を有していてもよい C_1-C_6 アルコキシ基、オキソ基を有していてもよい C_2-C_6 アルケニルオキシ基又はオキソ基を有していてもよい C_2-C_6 アルキニルオキシ基を示し、

。アルケノイルオキシ基及びオキソ基を有していてもよいC₃-C₂₀アルキノイルオキシ基からなる群である。)

で表される化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステルである。

本発明の化合物のうち、好適なものは、

- 2) R^1 が、(置換基群 A)から選択された置換基を有してもよい、 $C_4 C_{18}$ アルカノイル基又は $C_4 C_{18}$ アルケノイル基である化合物、
- 3) R^1 が、(置換基群A)から選択された置換基を有してもよい C_4-C_{18} アルカノイル基である化合物、
- 4) R^1 が、(置換基群 A)から選択された置換基を有してもよい、 $C_8 C_{16}$ アルカノイル基又は $C_8 C_{16}$ アルケノイル基である化合物、
- 5) R^1 が、(置換基群 A)から選択された置換基を有してもよい $C_8 C_{16}$ アルカノイル基である化合物、
- 6) R^1 が、無置換又は(置換基群 A)から選択された水酸基若しくはオキソ基を置換基として有する、 $C_{12}-C_{14}$ アルカノイル基又は $C_{12}-C_{14}$ アルケノイル基である化合物、
- 7) R^1 が、無置換又は(置換基群 A)から選択された水酸基若しくはオキソ基を置換基として有する、 $C_{12}-C_{14}$ アルカノイル基である化合物、
- 8) R¹が、無置換又は(置換基群 A) から選択された水酸基若しくはオキソ基を置換基として有する、ドデカノイル基、テトラデカノイル基、ドデセノイル基又はテトラデセノイル基である化合物、
- 9) R¹が、無置換又は(置換基群 A) から選択された水酸基若しくはオキソ基を置換基として有する、ドデカノイル基又はテトラデカノイル基である化合物、
- 10) R^2 が、(置換基群A)から選択された置換基を有してもよい、 $C_4 C_{18}$ アルキル基又は $C_4 C_{18}$ アルケニル基である化合物、
- 11) R^2 が、(置換基群A)から選択された置換基を有してもよい、 C_4-C_{18} アルキル基である化合物、
- 12) R^2 が、(置換基群A)から選択された置換基を有してもよい、 C_8-C_{16} アルキル基又は C_8-C_{16} アルケニル基である化合物、
- 13) R^2 が、(置換基群A) から選択された置換基を有してもよい、 C_8-C_{16} アル

キル基である化合物、

- 14) R^2 が、無置換又は(置換基群A)から選択された水酸基を置換基として有する、 $C_{10}-C_{14}$ アルキル基又は $C_{10}-C_{14}$ アルケニル基である化合物、
- 15) R^2 が、無置換又は(置換基群 A)から選択された水酸基を置換基として有する、 $C_{10}-C_{14}$ アルキル基である化合物、
- 16) R^2 が、無置換又は(置換基群 A)から選択された水酸基を置換基として有する、ドデシル基、テトラデシル基、5-ドデセニル基又は7-テトラデセニル基である化合物、
- 17) R^2 が、無置換又は(置換基群 A)から選択された水酸基を置換基として有する、ドデシル基又はテトラデシル基である化合物、
- 18) R^2 が、無置換の $C_{10}-C_{14}$ アルキル基である化合物、
- 19) R²が、無置換のデシル基、ドデシル基又はテトラデシル基である化合物、
- 20) R^3 が、無置換の $C_1 C_{16}$ アルカノイル基である化合物、
- 21) R^3 が、無置換の $C_1 C_8$ アルカノイル基である化合物、
- 22) R³が、無置換のC₁-C₂アルカノイル基である化合物、
- 23) R³が、ホルミル基、アセチル基又はプロピオニル基である化合物、
- 24) R³が、ホルミル基又はアセチル基である化合物、
- 25) R^4 が、(置換基群A)から選択された置換基を有してもよい、 C_4-C_{18} アルキル基又は C_4-C_{18} アルケニル基である化合物、
- 26) R^4 が、(置換基群A)から選択された置換基を有してもよい、 C_4-C_{18} アルキル基である化合物、
- 27) R^4 が、(置換基群A)から選択された置換基を有してもよい、 C_8-C_{16} アルキル基又は C_8-C_{16} アルケニル基である化合物、
- 28) R^4 が、(置換基群A)から選択された置換基を有してもよい、 C_8-C_{16} アルキル基である化合物、
- 29) R^4 が、(置換基群A)から選択されたフッ素原子、水酸基、無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルコキシ基、無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルカノイルオキシ基又は無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルカノイルオキシ基又は無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルケノイルオキシ基を置換基として有する、 $C_{10}-C_{14}$ アルキル基又は $C_{10}-C_{14}$ アルケルキル基である化合物、

- 30) R^4 が、(置換基群A)から選択されたフッ素原子、水酸基、無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルコキシ基、無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルカノイルオキシ基又は無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルケノイルオキシ基を置換基として有する、 $C_{10}-C_{14}$ アルキル基である化合物、
- 3 1) R^4 が、(置換基群 A)から選択されたフッ素原子、水酸基、無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルコキシ基又は無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルカノイルオキシ基を置換基として有する、 $C_{10}-C_{14}$ アルキル基である化合物、
- 3 3) R^4 が、(置換基群 A)から選択されたフッ素原子、水酸基、無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルコキシ基又は無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルケニルオキシ基を置換基として有する、 $C_{10}-C_{14}$ アルキル基である化合物、
- 3 4) R^4 が、(置換基群 A)から選択されたフッ素原子、水酸基又は無置換の C_{12} $-C_{14}$ アルコキシ基を置換基として有する、 C_{10} $-C_{14}$ アルキル基である化合物、
- 3 5) R^4 が、(置換基群 A) から選択されたフッ素原子、水酸基、無置換の C_{12} C_{14} アルケニルオキシ基を置換基として有する、 C_{10} $-C_{14}$ アルキル基である化合物、
- 36) R⁴が、(置換基群A)から選択されたドデシルオキシ基、テトラデシルオキシ基、5ードデセニルオキシ基、7ーテトラデセニルオキシ基、ドデカノイルオキシ基、テトラデカノイルオキシ基、5ードデセノイルオキシ基又は7ーテトラデセノイルオキシ基を置換基として有する、ドデシル基、テトラデシル基、5ードデセニル基又は7ーテトラデセニル基である化合物、
- 37) R⁴が、(置換基群A)から選択されたドデシルオキシ基、テトラデシルオキシ基、5ードデセニルオキシ基、7ーテトラデセニルオキシ基、ドデカノイルオキシ基、テトラデカノイルオキシ基、5ードデセノイルオキシ基又は7ーテトラデセノイルオキシ基を置換基として有する、ドデシル基又はテトラデシル基である化合物、
- 3 8) R⁴が、(置換基群A)から選択されたドデシルオキシ基、テトラデシルオキシ基、ドデカノイルオキシ基又はテトラデカノイルオキシ基を置換基として有する、ドデシル基又はテトラデシル基である化合物、

- 39) R⁴が、(置換基群A)から選択された5-ドデセニルオキシ基、7-テトラデセニルオキシ基、5-ドデセノイルオキシ基又は7-テトラデセノイルオキシ基を置換基として有する、ドデシル基又はテトラデシル基である化合物、
- 40) R⁴が、(置換基群A)から選択されたドデシルオキシ基、テトラデシルオキシ基、5ードデセニルオキシ基又は7ーテトラデセニルオキシ基を置換基として有する、ドデシル基又はテトラデシル基である化合物、
- 41) R⁴が、(置換基群A) から選択されたドデシルオキシ基又はテトラデシルオキシ基を置換基として有する、ドデシル基又はテトラデシル基である化合物、
- 42) R⁴が、(置換基群A)から選択された5ードデセニルオキシ基又は7ーテトラデセニルオキシ基を置換基として有する、ドデシル基又はテトラデシル基である化合物、
- 43) R^5 が、ハロゲン原子、水酸基又は無置換の $C_1 C_6$ アルコキシ基である化合物、
- 44) R⁵が、フッ素原子、水酸基又はメトキシ基である化合物である。 これらのうち、更に好適な化合物は、

カルボキシメチル $6-O-[2-Pセタミド-2-デオキシ-3-O-\{(R)-3-Fデシルオキシテトラデシル] -6-O-メチル-4-O-ホスホノー<math>\beta$ -D-グルコピラノシル] $-2-デオキシ-2-\{(R)-3-EFロキシテトラデカナミド\} -3-O-\{(R)-3-EFロキシテトラデシル\} -\alpha-D-グルコピラノシド、カルボキシメチル <math>6-O-[2-Pセタミド-2-デオキシ-3-O-\{(R)-3-Fデシル+2-F-Fデシル\} -4-O-ホスホノ-\beta-D-グルコピラノシル] -2-デオキシ-2-\{(R)-3-EFロキシテトラデカナミド\} -3-O-\{(R)-3-EFロキシテトラデシル\} -\alpha-D-グルコピラノシド、$

カルボキシメチル $6-O-[2-Pセタミド-2, 6-ジデオキシ-3-O-\{(R)-3-ドデシルオキシテトラデシル\}-6-フルオロー4-O-ホスホノー<math>\beta$ -D-グルコピラノシル] $-2-デオキシ-2-\{(R)-3-ヒドロキシテトラデカナミド\}-3-O-\{(R)-3-ヒドロキシテトラデシル\}-\alpha-D-グルコピラノシド、$

カルボキシメチル 3-0-デシル-2-デオキシ-6-0-[2-デオキシ-3

7

-O-[(R) -3-メトキシデシル]-2-[(Z) -11-オクタデセナミド] -4-O-ホスホノ-β-D-グルコピラノシル]-2-(3-オキソテトラデカナミド) $-\alpha-D-グルコピラノシド、$

カルボキシメチル $3-O-\overline{r}シル-2-\overline{r}オキシ-6-O-[2-\overline{r}オキシ-3$ $-O-[(R)-3-メトキシデシル]-6-O-メチル-2-[(Z)-11-オクタ デセナミド]-4-O-ホスホノ-<math>\beta$ -D-グルコピラノシル]-2-(3-オキソテトラデカナミド)- α -D-グルコピラノシド、

カルボキシメチル 6-O-[2-デオキシ-2-ホルムアミドー4-O-ホスホ $<math>J-3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]テトラデシル]-\beta$ $-D-グルコピラノシル]-2-デオキシ-3-O-ドデシル-2-(3-オキソテトラデカナミド) <math>-\alpha-D-グルコピラノシド$ 、

カルボキシメチル $6-O-[2-アセタミド-2-デオキシ-4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]テトラデシル]-<math>\beta-D-$ グルコピラノシル]-2-デオキシ-3-O-ドデシル-2-(3-オキソテトラデカナミド) $-\alpha-D-$ グルコピラノシド、

カルボキシメチル 6-O-[2-デオキシ-2-ホルムアミド-6-O-メチル -4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ] テトラデシル] $-\beta-D-$ グルコピラノシル] -2- デオキシ-3-O- ドデシル-2- $-(3-オキソテトラデカナミド) <math>-\alpha-D-$ グルコピラノシド、

カルボキシメチル $6-O-[2-Pセタミド-2-デオキシ-6-O-メチルー4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]テトラデシル]-<math>\beta-D-$ グルコピラノシル]-2-デオキシ-3-O-ドデシル-2-(3-オキソテトラデカナミド) $-\alpha-D-$ グルコピラノシドである。

また、本発明は、上記化合物(I)を有効成分として含有する医薬であり、特に、 炎症の予防剤又は治療剤、自己免疫疾患の予防剤又は治療剤、免疫抑制剤、あるいは、 敗血症の予防剤又は治療剤である。

上記式(I)中、 R^1 及び R^3 における「下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_1-C_2 。アルカノイル基」の「 C_1-C_2 。アルカノイル基」、及び、(置換基群A)における「オキソ基を有していてもよい C_1-C_2 。ア

ルカノイルオキシ基」の「 C_1-C_{20} アルカノイル」部分としては、例えば、ホルミル(但し、オキソ基が置換基である場合は除く)、アセチル、プロピオニル、イソプロピオニル、ブチリル、イソブチリル、sec ーブチリル、tertーブチリル、バレリル、イソバレリル、ピバロイル、ヘキサノイル、イソヘキサノイル、ヘプタノイル、イソヘプタノイル、インカクタノイル、インナノイル、デカノイル、オクタノイル、インオクタノイル、ノナノイル、イソノナノイル、デカノイル、イソデカノイル、ウンデカノイル、イソウンデカノイル、ラウロイル、イソラウロイル、トリデカノイル、イソトリデカノイル、ミリストイル、ペンタデカノイル、パルミトイル、ヘプタデカノイル、ステアロイル、イソステアロイル、ノナデカノイル、イコサノイル基のような直鎖又は分枝鎖の C_1-C_{20} アルカノイル基があげられ、

 R^1 及び(置換基群 A)においては、好適には、 C_4-C_{18} アルカノイル基であり、より好適には、 C_8-C_{16} アルカノイル基であり、さらに好適には、 $C_{12}-C_{14}$ アルカノイル基であり、特に好適には、ラウロイル基又はミリストイル基であり、

 R^3 においては、好適には、 C_1-C_{16} アルカノイル基であり、より好適には、 C_1-C_{8} アルカノイル基であり、さらに好適には、 C_1-C_{4} アルカノイル基であり、特に好適には、アセチル基又はプロピオニル基であり、最適には、アセチル基である。

上記式(I)中、 R^1 及び R^3 における「下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_3-C_{20} アルケノイル基」の「 C_3-C_{20} アルケノイル基」、及び、(置換基群A)における「オキソ基を有していてもよい C_3-C_{20} アルケノイルオキシ基」の「 C_3-C_{20} アルケノイル」部分としては、上記であげた C_1-C_{20} アルカノイル基のうち、炭素数 3 乃至 2 0 個のものであって、1 乃至 3 個の二重結合を有する基があげられ、

 R^{1} 及び(置換基群A)においては、好適には、 $C_{4}-C_{18}$ アルケノイル基であり、さらに好適には、 $C_{12}-C_{14}$ アルケノイル基(特に、5-ドデセノイル基又は7-テトラデセノイル基)であり、

 R^3 においては、好適には、 $C_3 - C_{16}$ アルケノイル基であり、さらに好適には、 $C_3 - C_4$ アルケノイル基(特に、3 - 7テノイル基)である。

上記式(I)中、 R^1 及び R^3 における「下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_3-C_{20} アルキノイル基」の「 C_3-C_{20} アルキノイ

9

ル基」、及び、(置換基群A)における「オキソ基を有していてもよい C_3-C_{20} アルキノイルオキシ基」の「 C_3-C_{20} アルキノイル」部分としては、上記であげた C_1-C_{20} アルカノイル基のうち、炭素数 3 乃至 2 0 個のものであって、1 乃至 3 個の三重結合を有する基があげられ、

 R^1 及び(置換基群 A)においては、好適には、 $C_4 - C_{18}$ アルキノイル基であり、さらに好適には、 $C_{12} - C_{14}$ アルキノイル基(特に、5 -ドデシノイル基又は7 -テトラデシノイル基)であり、

 R^3 においては、好適には、 C_3-C_{16} アルキノイル基であり、さらに好適には、 C_3-C_4 アルキノイル基(特に、3-ブチノイル基)である。

上記式(Ⅰ)中、R²及びR⁴における「下記(置換基群A)から選択された一種以 上の基で置換されていてもよいC₁-C₂₀アルキル基」の「C₁-C₂₀アルキル基」と しては、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、 s ーブチル、tertーブチル、ペンチル、イソペンチル、2 ーメチルブチル、ネオペン チル、1-エチルプロピル、ヘキシル、イソヘキシル、4-メチルペンチル、3-メ チルペンチル、2-メチルペンチル、1-メチルペンチル、3,3-ジメチルブチル、 2, 2-ジメチルブチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、2-エチルブチル、ヘプチル、1-メチルヘキシル、2-メチルヘキシル、3-メチルヘキシル、4-メチルヘキシル、 5-メチルヘキシル、1-プロピルブチル、4,4-ジメチルペンチル、オクチル、 1-メチルヘプチル、2-メチルヘプチル、3-メチルヘプチル、4-メチルヘプチ ル、5-メチルヘプチル、6-メチルヘプチル、1-プロピルペンチル、2-エチル ヘキシル、5,5-ジメチルヘキシル、ノニル、3-メチルオクチル、4-メチルオ クチル、5-メチルオクチル、6-メチルオクチル、1-プロピルヘキシル、2-エ チルヘプチル、6,6-ジメチルヘプチル、デシル、1-メチルノニル、3-メチル ノニル、8-メチルノニル、3-エチルオクチル、3,7-ジメチルオクチル、7, 7ージメチルオクチル、ウンデシル、4,8ージメチルノニル、ドデシル、トリデシ ル、テトラデシル、ペンタデシル、3,7,11-トリメチルドデシル、ヘキサデシ ル、4,8,12-トリメチルトリデシル、1-メチルペンタデシル、14-メチル ペンタデシル、13,13-ジメチルテトラデシル、ヘプタデシル、15-メチルへ

キサデシル、オクタデシル、1-メチルへプタデシル、ノナデシル、イコシル又は3、7, 11, 15-テトラメチルへキサデシル基のような炭素数1乃至20個の直鎖又は分枝鎖アルキル基があげられ、好適には、 C_4-C_{18} アルキル基であり、より好適には、 C_8-C_{16} アルキル基であり、さらに好適には、 $C_{12}-C_{14}$ アルキル基であり、特に好適には、ドデシル基又はテトラデシル基である。

上記式(I)中、 R^2 及び R^4 における「下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_2-C_{20} アルケニル基」の「 C_2-C_{20} アルケニル基」としては、上記であげた C_1-C_{20} アルキル基のうち、炭素数 2 乃至 2 0 個のものであって、1 乃至 3 個の二重結合を有する基があげられ、好適には、 C_4-C_{18} アルケニル基であり、さらに好適には、 $C_{12}-C_{14}$ アルケニル基(特に、5-ドデセニル基又は 7-テトラデセニル基)である。

上記式(I)中、 R^2 及び R^4 における「下記(置換基群A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_2-C_{20} アルキニル基」の「 C_2-C_{20} アルキニル基」としては、上記であげた C_1-C_{20} アルキル基のうち、炭素数 2 乃至 2 0 個のものであって、1 乃至 3 個の三重結合を有する基があげられ、好適には、 C_4-C_{18} アルキニル基であり、さらに好適には、 $C_{12}-C_{14}$ アルキニル基(特に、5-ドデシニル基又は 7-テトラデシニル基)である。

上記式(I)中、R⁵及び(置換基群A)における「ハロゲン原子」としては、例 えば、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素原子があげられ、好適には、フッ素、塩素又は 臭素原子であり、さらに好適には、フッ素原子である。

上記式(I)中、 R^5 における「オキソ基を有していてもよい C_1-C_6 アルコキシ基」の「 C_1-C_6 アルコキシ基」としては、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、sーブトキシ、tertーブトキシ、ペンチルオキシ、イソペンチルオキシ、2-メチルブチルオキシ、ネオペンチルオキシ、1-エチルプロピルオキシ、ヘキシルオキシ、イソヘキシルオキシ、4-メチルペンチルオキシ、3-メチルペンチルオキシ、2-メチルペンチルオキシ、1-メチルペンチルオキシ、3,3-ジメチルブチルオキシ、2,2-ジメチルブチルオキシ、1,1-ジメチルブチルオキシ、1,2-ジメチルブチルオキシ、1,3-ジメチルブチルオキシ、2,3-ジメチルブチルオキシスは2-エチルブチルオキシ基のような炭

11

素数1乃至6個の直鎖又は分枝鎖アルコキシ基があげられ、好適には、炭素数1乃至4個の直鎖又は分枝鎖アルコキシ基であり、さらに好適には、メトキシ基である。

上記式(I)中、 R^{5} における「オキソ基を有していてもよい $C_{2}-C_{6}$ アルケニルオキシ基」の「 $C_{2}-C_{6}$ アルケニルオキシ基」としては、上記であげた $C_{1}-C_{6}$ アルコキシ基のうち、炭素数 2 乃至 6 個のものであって、1 乃至 3 個の二重結合を有する基があげられ、好適には、 $C_{2}-C_{4}$ アルケニルオキシ基(特に、3 - ブテニルオキシ基)である。

上記式(I)中、 R^5 における「オキソ基を有していてもよい C_2-C_6 アルキニルオキシ基」の「 C_2-C_6 アルキニルオキシ基」としては、上記であげた C_1-C_6 アルコキシ基のうち、炭素数 2 乃至 6 個のものであって、1 乃至 3 個の三重結合を有する基があげられ、好適には、 C_2-C_4 アルキニルオキシ基(特に、3-ブチニルオキシ基)である。

上記式(I)中、(置換基群A)における「オキソ基を有していてもよい $C_1 - C_2$ 。アルコキシ基」としては、上記であげた「C₁-C₂₀アルキル基」に酸素原子が結合 している基があげられ、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、 ブトキシ、イソブトキシ、sーブトキシ、tertーブトキシ、ペンチルオキシ、イソペ ンチルオキシ、2-メチルブチルオキシ、ネオペンチルオキシ、1-エチルプロピル オキシ、ヘキシルオキシ、イソヘキシルオキシ、4-メチルペンチルオキシ、3-メ チルペンチルオキシ、2-メチルペンチルオキシ、1-メチルペンチルオキシ、3, 3-ジメチルブチルオキシ、2,2-ジメチルブチルオキシ、1,1-ジメチルブチ ルオキシ、1,2-ジメチルブチルオキシ、1,3-ジメチルブチルオキシ、2,3 ージメチルブチルオキシ、2ーエチルブチルオキシ、ヘプチルオキシ、4ーメチルへ キシルオキシ、1-プロピルブチルオキシ、4,4-ジメチルペンチルオキシ、オク チルオキシ、6-メチルヘプチルオキシ、5,5-ジメチルヘキシルオキシ、ノニル オキシ、デシルオキシ、1-メチルノニルオキシ、3-メチルノニルオキシ、8-メ チルノニルオキシ、3-エチルオクチルオキシ、3,7-ジメチルオクチルオキシ、 7, 7-ジメチルオクチルオキシ、ウンデシルオキシ、4, 8-ジメチルノニルオキ シ、ドデシルオキシ、トリデシルオキシ、テトラデシルオキシ、ペンタデシルオキシ、 3, 7, 11-トリメチルドデシルオキシ、ヘキサデシルオキシ、4, 8, 12-ト

上記式(I)中、(置換基群A)における「オキソ基を有していてもよい C_2-C_2 。アルケニルオキシ基」としては、上記であげた「 C_1-C_{20} アルコキシ基」のうち、 炭素数 2 乃至 2 0 個のものであって、1 乃至 3 個の二重結合を有する基があげられ、 好適には、 C_4-C_{18} アルケニルオキシ基であり、さらに好適には、 $C_{12}-C_{14}$ アルケニルオキシ基(特に、5-ドデセニルオキシ基又は7-テトラデセニルオキシ基)である。

上記式(I)中、(置換基群A)における「オキソ基を有していてもよい C_2-C_2 。アルキニルオキシ基」としては、上記であげた「 C_1-C_{20} アルコキシ基」のうち、炭素数 2 乃至 2 0 個のものであって、1 乃至 3 個の三重結合を有する基があげられ、好適には、 C_4-C_{18} アルキニルオキシ基であり、さらに好適には、 $C_{12}-C_{14}$ アルキニルオキシ基(特に、5-ドデシニルオキシ基又は7-テトラデシニルオキシ基)である。

上記式(I)中、(置換基群A)の置換位置は、好適には、3位である。

上記式(I)中、好適な R^1 は、(置換基群 A)から選択された置換基を有してもよい、 C_4-C_{18} アルカノイル基又は C_4-C_{18} アルケノイル基であり、より好適には、(置換基群 A)から選択された置換基を有してもよい、 C_8-C_{16} アルカノイル基又は C_8-C_{16} アルケノイル基であり、更に好適には、無置換又は(置換基群 A)から選択された水酸基若しくはオキソ基を置換基として有する、 $C_{12}-C_{14}$ アルカノイル基又は $C_{12}-C_{14}$ アルケノイル基であり、特に好適には、無置換又は(置換基群 A)から選択された水酸基若しくはオキソ基を置換基として有する、ドデカノイル基、テトラデカノイル基、5-ドデセノイル基又は7-テトラデセノイル基である。

13

上記式(I)中、好適な R^2 は、(置換基群A)から選択された置換基を有してもよい、 C_4-C_{18} アルキル基又は C_4-C_{18} アルケニル基であり、より好適には、(置換基群A)から選択された置換基を有してもよい、 C_8-C_{16} アルキル基又は C_8-C_{16} アルケニル基であり、更に好適には、無置換又は(置換基群A)から選択された水酸基を置換基として有する、 $C_{10}-C_{14}$ アルキル基又は $C_{10}-C_{14}$ アルケニル基であり、特に好適には、無置換又は(置換基群A)から選択された水酸基を置換基として有する、デシル基、ドデシル基、カら選択された水酸基を置換基として有する、デシル基、ドデシル基、テトラデシル基、5-ドデセニル基又は7-テトラデセニル基であり、更に特に好適には、無置換の $C_{10}-C_{14}$ アルキル基であり、最も好適には、無置換のデシル基、ドデシル基又はテトラデシル基である。

上記式(I)中、好適な R^3 は、無置換の $C_1 - C_{16}$ アルカノイル基であり、より好適には、無置換の $C_1 - C_8$ アルカノイル基であり、さらに好適には、無置換の $C_1 - C_4$ アルカノイル基であり、特に好適には、ホルミル基、アセチル基又はプロピオニル基であり、最適には、ホルミル基又はアセチル基である。

上記式(I)中、好適な R^4 は、(置換基群A)から選択された置換基を有してもよい、 C_4-C_{18} アルキル基又は C_4-C_{18} アルケニル基であり、より好適には、(置換基群A)から選択された置換基を有する、 C_8-C_{16} アルキル基又は C_8-C_{16} アルケニル基であり、更に好適には、(置換基群A)から選択されたフッ素原子、水酸基、無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルコキシ基、無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルカノイルオキシ基又は無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルケノイルオキシ基を置換基として有する、 $C_{12}-C_{14}$ アルキル基又は $C_{12}-C_{14}$ アルケニル基であり、特に好適には、(置換基群A)から選択されたドデシルオキシ基、テトラデシルオキシ基、5-ドデセニルオキシ基、7-テトラデセニルオキシ基、ドデカノイルオキシ基、テトラデカノイルオキシ基、5-ドデセノイルオキシ基又は1-テトラデセニルオキシ基と置換基として有する、ドデシル基、テトラデシル基、1-ドデセニルオキシ基と置換基として有する、ドデシル基、1-ドデセニル基である。

上記式(I) 中、好適な R^5 は、ハロゲン原子、水酸基又は無置換の C_1 - C_6 アルコキシ基であり、より好適には、フッ素原子、水酸基又はメトキシ基である。

上記式(I)の化合物は、塩にすることができるが、そのような塩としては、好適には、ナトリウム塩、カリウム塩、マグネシウム塩又はカルシウム塩のようなアルカ

リ金属又はアルカリ土類金属の塩;トリエチルアミン塩、トリメチルアミン塩のよう な有機塩基の塩を挙げることができる。

また、本発明の化合物(I)は、大気中に放置しておくことにより、水分を吸収し、 吸着水が付いたり、水和物となる場合があり、そのような塩も本発明に包含される。

さらに、本発明の化合物(I)は、他のある種の溶媒を吸収し、溶媒和物となる場合があるが、そのような塩も本発明に包含される。

上記式(I)の化合物は、エステルを形成することができるが、そのエステルを形成する置換基としては、次の(a)~(f)の式を有するものを挙げることができ、「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護基」や、加水素分解、加水分解、電気分解、光分解のような化学的方法により開裂し得る「反応における保護基」を示す。

(a) $-CHR^aR^b$

WO 01/77133

- (b) $-CHR^cR^d$
- (c) $(CHR^e) n OCOR^f$
- (d) $(CHR^e) n OR^g$
- (e) $-S i R^g R^h R^I$
- (f) $-CH_2-Ph-COOR^I$

上記式中、

nは、1乃至2を示し、

Phは、フェニル基を示し、

R°は、水素原子、低級アルキル基、アリール置換された低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、脂肪族アシル基、又は、アリール置換された脂肪族アシル基を示し、好適には、水素原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルケニル基、又は、低級アルキニル基であり、更に好適には、水素原子、炭素数1乃至3個のアルキル基、ハロゲノ炭素数1乃至3個のアルキル基、炭素数2乃至3個の低級アルキニル基である。

Rbは、水素原子又は低級アルキル基を示し、好適には、水素原子である。

R°は、アリール基又は置換されたアリール基(該置換基としては、低級アルキル基、

低級アルコキシ基、ハロゲン原子及びニトロ基を挙げることができる。)を示し、好適には、低級アルコキシ化アリール基、ハロゲン化アリール基又はニトロ化アリール基であり、更に好適には、低級アルコキシ化フェニル基、ハロゲン化フェニル基又はニトロ化フェニル基である。

Rdは、水素原子又はR°で定義した基を示す。

R°は、水素原子又は低級アルキル基を示し、好適には、水素原子又は炭素数1乃至3個のアルキル基である。

R^fは、低級アルキル基、低級アルコキシ基又はR^fで定義した基を示し、好適には、低級アルキル基又は低級アルコキシ基であり、更に好適には、炭素数1乃至3個のアルコキシ基である。

又、R°及びRfは、一緒になって、フタリジル基又はモノ若しくはジ置換のフタリジル基(該置換基としては、低級アルキル基又は低級アルコキシ基を挙げることができる。)を示してもよい。

R[®]及びR^hは、同一又は異なって、低級アルキル基又はR[®]で定義した基を示し、好適には、低級アルキル基であり、更に好適には、炭素数1万至3個のアルキル基である。

R¹は、低級アルキル基を示し、好適には、炭素数1万至3個のアルキル基である。 上記「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護基」及び「反応における保護基」としては、具体的には、以下の基があげられる。

すなわち、「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護基」としては、好適には、メトキシメチル、1ーエトキシエチル、1ーメチルー1ーメトキシエチル、tertーブトキシメチル、フェノキシメチル、アセトキシメチル、ピバロイルオキシメチル、シクロペンタノイルオキシメチル、1ーシクロヘキサノイルオキシブチル、ベンゾイルオキシメチル、メトキシカルボニルオキシメチル、2ープロポキシカルボニルオキシエチルであり、

「反応における保護基」としては、好適には、メチル、エチル、nープロピル、イソプロピル、nーブチル、イソブチル、sーブチル、tertーブチル、nーペンチル、イソペンチル、2ーメチルブチル、ネオペンチル、1ーエチルプロピル、nーヘキシル、イソヘキシル、4ーメチルペンチル、3ーメチルペンチル、2ーメチルペンチル、1

ーメチルペンチル、3,3-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、2-エチル ブチル : エテニル、1 ープロペニル、2 ープロペニル、1 ーメチルー2 ープロペニル、 2-メチル-1-プロペニル、2-エチル-2-プロペニル、1-ブテニル、3-メ チルー2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-ペンテニル、 1-メチル-3-ペンテニル、2-ヘキセニル:エチニル、2-プロピニル、2-メ チルー2-プロピニル、2-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-エチル-2 ーブチニル、2ーペンチニル、3ーペンチニル、4ーペンチニル、2ーヘキシニル; アセチルメチル;ベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピル、α-ナフチルメチ ル、βーナフチルメチル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、6-フェニルへ キシル、αーナフチルジフェニルメチル、9ーアンスリルメチル、4ーメチルベンジ ル、2,4,6-トリメチルベンジル、3,4,5-トリメチルベンジル、4-メト キシベンジル、4-メトキシフェニルジフェニルメチル、2-ニトロベンジル、4-ニトロベンジル、4-クロロベンジル、4-ブロモベンジル、4-シアノベンジル、 4-シアノベンジルジフェニルメチル、ビス(2-ニトロフェニル)メチル、4-メ トキシカルボニルベンジル:トリメチルシリル、トリエチルシリル、イソプロピルジ メチルシリル、tertーブチルジメチルシリル、メチルジイソプロピルシリル、メチル ジ tertーブチルシリル、トリイソプロピルシリル、メチルジフェニルシリル、イソプ ロピルジフェニルシリル、ブチルジフェニルシリル、フェニルジイソプロピルシリル 基である。

上記式(I)の化合物は、分子中に不斉炭素を有し、各々がS配位、R配位である立体異性体が存在するが、その各々、或いはそれらの混合物のいずれも本発明に包含される。

本発明の化合物としては、例えば、表1に記載されるものをあげることができるが、 本発明は、これらのものに限定されない。

表1において、略号は以下の基または符号を示す。

Ac はアセチル基を示し、Bu はブチル基を示し、Byr はブチリル基を示し、Dc はデシル基を示し、Dco はデカノイル基を示し、Ddc はドデシル基を示し、Ddce はドデセニル基を示し、Ei はイコシル基を示し、Ei はイコサノイル基を示し、Ei はイコセニル基を示し、Fo はホルミル基を示し、Hx はヘキシル基を示し、Hdc はヘキサデシル基

を示し、Hdce はヘキサでセニル基を示し、Hxn はヘキサノイル基を示し、Lau はラウロイル基 (ドデカノイル基)を示し、Me はメチル基を示し、Myr はミリストイル基 (テトラデカノイル基)を示し、Oc はオクチル基を示し、Odc はオクタデシル基を示し、Odce はオクタデセニル基を示し、Octo はオクタノイル基を示し、=0 はオキソ基 (炭素と一緒になってカルボニル基)を示し、Pal はパルミトイル基 (ヘキサデカノイル基)を示し、Pdce はペンタデセニル基を示し、Prn はプロピオニル基を示し、Ste はステアロイル基 (オクタデカノイル基)を示し、Tdce はトリデセニル基を示し、Tedc はテトラデシル基を示し、Tedce はテトラデシル基を示し、Tedce はテトラデセニル基を示し、Val はバレリル基を示す。

$$(HO)_{2}P-O^{"}OR^{4}$$

$$(I)$$

$$OR^{5}OCH_{2}COOH$$

$$OR^{2}$$

$$OR^{2}$$

[表1]

化合物 N c	·	R²	R^3	R ⁴	R⁵
1	3-0H-Lau	3-0H-Ddc	 Fo	3-ODdc-Tedc	 OMe
2	3-0H-Lau	3-0H-Ddc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
3	3-OH-Lau	3-0H-Ddc	Prn	3-ODdc-Tedc	OMe
4	3-0H-Lau	3-0H-Ddc	Byr	3-ODdc-Tedc	OMe
5	3-0H-Lau	3-OH-Ddc	Hxn	3-ODdc-Tedc	OMe
6	3-0H-Lau	3-OH-Ddc	Octo	3-ODdc∸Tedc	OMe
7	Myr	Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
8	Myr	Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
9	Myr	Tedc	Prn	3-ODdc-Tedc	OMe
10	Myr	`Tedc	Byr	3-ODdc-Tedc	OMe
11	Myr	Tedc	Hxn	3-ODdc-Tedc	OMe

18

12	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
13	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
14	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Prn	3-ODdc-Tedc	OMe
15	3-0H-Myr	3-0H-Tedc	Byr	3-ODdc-Tedc	OMe
16	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Val	3-ODdc-Tedc	OMe
17	3-OH-Myr	3-0H-Tedc	Hxn	3-ODdc-Tedc	OMe
18	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Octo	3-ODdc-Tedc	OMe
19	3-0H-Myr	3-0H-Tedc	Dco	3-ODdc-Tedc	ОМе
20	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Lau	3-ODdc-Tedc	ОМе
21	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Myr	3-ODdc-Tedc	OMe
22	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Pal	3-ODdc-Tedc	OMe
23	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Ste	3-ODdc-Tedc	OMe
24	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Eicn	3-ODdc-Tedc	OMe
25	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-OAc-Byr	3-0Bu-Bu	ОМе
26	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OByr-Hxn	3-0Hx-Hx	OMe
27	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OHxn-Octo	3-00c - 0c	OMe
28	3-OH-Myr	3-0H-Tedc	3-OOcto-Dco	3-ODc-Dc	OMe
29	3-OH-Myr	3-0H-Tedc	3-ODco-Lau	3-ODdc-Ddc	OMe
30	3-OH-Myr	3-0H-Tedc	3-OLau-Myr	3-ODdc-Tedc	ОМе
31	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OH-Myr	3-ODdc-Tedc	OMe
32	3-0H-Myr	3-0H-Tedc	3-OLau-Myr	3-OH-Tedc	OMe
33	3-0H-Myr	3-0H-Tedc	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	OMe
34	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-(=0)-Myr	3-0H-Tedc	OMe
35	3-OH-Myr	3-0H-Tedc	3-OH-Myr	3-(=0)-Tedc	OMe
36	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	2-F-3-OLau-Myr	2-F-3-ODdc-Tedc	OMe
37	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	2-F-3-OH-Dco	3-ODdc-Tedc	OMe
38	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	2-C1-3-OLau-Myr	2-C1-3-ODdc-Tedc	ОМе
39	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-OLau-Myr	3-OTedc-Ddc	OMe
40	3-OH-Myr	3-0H-Tedc	3-OLau-Myr	3-OTedc-Ddc	OMe

19

41	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-0Lau-Lau	3-ODdc-Tedc	OMe
42	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OMyr-Pal	3-OHdc-Hdc	OMe
43	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OPal-Ste	3-00dc-0dc	OMe
44	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OSte-Eicn	3-0Ei-Ei	OMe
45	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Fo	3-OTedc-Tedc	OMe
46	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Ac	3-OTedc-Tedc	OMe
47	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Prn	3-OTedc-Tedc	OMe
48	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Byr	3-OTedc-Tedc	OMe
49	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Val	3-OTedc-Tedc	OMe
50	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Hxn	3-OTedc-Tedc	OMe
51	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Fo	3-OTedc-Ddc	ОМе
52	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Ac	3-OTedc-Ddc	OMe
53	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Prn	3-OTedc-Ddc	OMe
54	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Byr	3-OTedc-Ddc	OMe
55	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Val	3-OTedc-Ddc	OMe
56	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Hxn	3-OTedc-Ddc	OMe
57	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Fo	3-ODdc-Ddc	OMe
58	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Ac	3-ODdc-Ddc	OMe
59	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Prn	3-ODdc-Ddc	OMe
60	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Byr	3-ODdc-Ddc	OMe
61	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Val	3-ODdc-Ddc	OMe
62	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Hxn	3-ODdc-Ddc	OMe
63	3-OH-Lau	3-OH-Ddc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
64	3-0H-Lau	3-OH-Ddc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
65	3-0H-Lau	3-OH-Ddc	Prn	3-ODdc-Tedc	ОН
66	3-0H-Lau	3-OH-Ddc	Byr	3-ODdc-Tedc	ОН
67	3-OH-Lau	3-OH-Ddc	Hxn	3-ODdc-Tedc	ОН
68	3-OH-Lau	3-OH-Ddc	Octo	3-ODdc-Tedc	ОН
69	Myr	Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН

20

			•		
70	Myr	Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
71	Myr	Tedc	Prn	3-ODdc-Tedc	ОН
72	Myr	Tedc	Byr	3-ODdc-Tedc	ОН
73	Myr	Tedc	Hxn	3-ODdc-Tedc	ОН
74	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
75	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
76	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Prn	3-ODdc-Tedc	ОН
77	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Byr	3-ODdc-Tedc	ОН
78	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Val	3-ODdc-Tedc	ОН
79	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Hxn	3-ODdc-Tedc	ОН
80	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Octo	3-ODdc-Tedc	ОН
81	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Dco	3-ODdc-Tedc	ОН
82	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Lau	3-ODdc-Tedc	ОН
83	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Myr	3-ODdc-Tedc	ОН
84	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Pal	3-ODdc-Tedc	ОН
85	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Ste	3-ODdc-Tedc	ОН
86	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Eicn	3-ODdc-Tedc	ОН
87	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OAc-Byr	3-OBu-Bu	ОН
88	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OByr-Hxn	3-ОНх-Нх	ОН
89	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OHxn-Octo	3-00c-0c	ОН
90	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OOcto-Dco	3-ODc-Dc	ОН
91	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-ODco-Lau	3-ODdc-Ddc	ОН
92	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OLau-Myr	3-ODdc-Tedc	OĤ
93	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OH-Myr	3-ODdc-Tedc	ОН
94	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OLau-Myr	3-OH-Tedc	ОН
95	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	ОН
96	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-(=0)-Myr	3-0H-Tedc	ОН
97	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OH-Myr	3-(=0)-Tedc	ОН
98	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	2-F-3-OLau-Myr	2-F-3-ODdc-Tedc	ОН

99	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	2-F-3-OH-Dco	3-ODdc-Tedc	ОН
100	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	2-C1-3-OLau-Myr	2-C1-3-ODdc-Tedc	ОН
101	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OLau-Myr	3-OTedc-Ddc	ОН
102	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OLau-Myr	3-OTedc-Ddc	ОН
103	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-0Lau-Lau	3-ODdc-Tedc	ОН
104	3-0H-Myr	3-0H-Tedc	3-OMyr-Pal	3-OHdc-Hdc	ОН
105	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-OPal-Ste	3-00dc-0dc	ОН
106	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-OSte-Eicn	3-0Ei-Ei	ОН
107	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Fo	3-OTedc-Tedc	ОН
108	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Ac	3-OTedc-Tedc	ОН
109	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Prn	3-OTedc-Tedc	ОН
110	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Byr	3-OTedc-Tedc	ОН
111	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Val	3-OTedc-Tedc	ОН
112	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Hxn	3-OTedc-Tedc	ОН
113	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Fo	3-OTedc-Ddc	ОН
114	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Ac	3-OTedc-Ddc	ОН
115	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Prn	3-OTedc-Ddc	ОН
116	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Byr	3-OTedc-Ddc	ОН
117	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Val	3-OTedc-Ddc	ОН
118	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Hxn	3-OTedc-Ddc	ОН
119	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Fo	3-ODdc-Ddc	ОН
120	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Ac	3-ODdc-Ddc	ОН
121	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Prn	3-ODdc-Ddc	ОН
122	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Byr	3-ODdc-Ddc	ОН
123	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Val	3-ODdc-Ddc	ОН
124	3-0H-Myr	3-0H-Tedc	Hxn	3-ODdc-Ddc	ОН
125	3-0H-Lau	3-OH-Ddc	Fo	3-ODdc-Tedc	F
126	3-0H-Lau	3-OH-Ddc	Ac	3-ODdc-Tedc	F
127	3-0H-Lau	3-0H-Ddc	Prn	3-ODdc-Tedc	F

22

128	3-0H-Lau	3-0H-Ddc	Byr	3-ODdc-Tedc	F
129	3-0H-Lau	3-0H-Ddc	Hxn	3-ODdc-Tedc	F
130	3-0H-Lau	3-0H-Ddc	Octo	3-ODdc-Tedc	F
131	Myr	Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	F
132	Myr	Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	F
133	Myr	Tedc	Prn	3-ODdc-Tedc	F
134	Myr	Tedc	Byr	3-ODdc-Tedc	F
135	Myr	Tedc	Hxn	3-ODdc-Tedc	F
136	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	F
137	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	F
138	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Prn	3-ODdc-Tedc	F
139	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Byr	3-ODdc-Tedc	F
140	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Val	3-ODdc-Tedc	F
141	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Hxn	3-ODdc-Tedc	F
142	3-OH-Myr	3-0H-Tedc	Octo	3-ODdc-Tedc	F
143	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Dco	3-ODdc-Tedc	F
144	3-OH-Myr	3-0H-Tedc	Lau	3-ODdc-Tedc	F
145	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Myr	3-ODdc-Tedc	F
146	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Pal	3-ODdc-Tedc	F
147	3-0H-Myr	3-0H-Tedc	Ste	3-ODdc-Tedc	F
148	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Eicn	3-ODdc-Tedc	F
149	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-OAc-Byr	3-OBu-Bu	F
150	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OByr-Hxn	3-ОНх-Нх	F
151	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-OHxn-Octo	3-00c-0c	F
152	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-OOcto-Dco	3-0Dc-Dc	F
153	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-ODco-Lau	3-ODdc-Ddc	F
154	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OLau-Myr	3-ODdc-Tedc	F
155	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-OH-Myr	3-ODdc-Tedc	F
156					

157	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	F
158	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	F
159	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OH-Myr	3-(=0)-Tedc	F
160	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	2-F-3-OLau-Myr	2-F-3-ODdc-Tedc	F
161	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	2-F-3-OH-Dco	3-ODdc-Tedc	F
162	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	2-C1-3-OLau-Myr	2-C1-3-ODdc-Tedc	F
163	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OLau-Myr	3-OTedc-Ddc	F
164	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OLau-Myr	3-OTedc-Ddc	F
165	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-0Lau-Lau	3-ODdc-Tedc	F
166	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OMyr-Pal	3-OHdc-Hdc	F
167	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-0Pal-Ste	3-00dc-0dc	F
168	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-OSte-Eicn	3-0Ei-Ei	F
169	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Fo	3-OTedc-Tedc	F
170	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Ac	3-0Tedc-Tedc	F
171	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Prn	3-OTedc-Tedc	F
172	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Byr	3-OTedc-Tedc	F
173	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Val	3-0Tedc-Tedc	F
174	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Hxn	3-OTedc-Tedc	F
175	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Fo	3-OTedc-Ddc	F
176	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Ac	3-OTedc-Ddc	F
177	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Prn	3-OTedc-Ddc	F
178	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Byr	3-OTedc-Ddc	F
179	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Val	3-OTedc-Ddc	F
180	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Hxn	3-OTedc-Ddc	F
181	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Fo	3-ODdc-Ddc	F
182	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Ac	3-ODdc-Ddc	F
183	3-0H-Myr	3-0H-Tedc	Prn	3-ODdc-Ddc	F
184	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Byr	3-ODdc-Ddc	F
185	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Val	3-ODdc-Ddc	F

24

186	3-OH-Myr	3-0H-Tedc	Hxn	3-ODdc-Ddc	F
187	3-0H-Lau	3-OH-Ddc	Fo	3-ODdc-Tedc	Н
188	3-0H-Lau	3-OH-Ddc	Ac	3-ODdc-Tedc	H
189	3-0H-Lau	3-0H-Ddc	Prn	3-ODdc-Tedc	Н
190	3-0H-Lau	3-OH-Ddc	Byr	3-ODdc-Tedc	Н
191	3-0H-Lau	3-OH-Ddc	Hxn	3-ODdc-Tedc	Н
192	3-0H-Lau	3-0H-Ddc	Octo	3-ODdc-Tedc	Н
193	Myr	Tedc	Fo	3-0Ddc-Tedc	Н
194	Myr	Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	Н
195	Myr	Tedc	Prn	3-ODdc-Tedc	Н
196	Myr	Tedc	Byr	3-ODdc-Tedc	Н
197	Myr	Tedc	Hxn	3-ODdc-Tedc	Н
198	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	Н
199	3-OH-Myr	3 - 0H-Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	Н
200	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Prn	3-ODdc-Tedc	Н
201	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Byr	3-ODdc-Tedc	Н
202	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Val	3-ODdc-Tedc	Н
203	3-0H-Myr	3-0H-Tedc	Hxn	3-ODdc-Tedc	Н
204	3-OH-Myr	3-0H-Tedc	Octo	3-ODdc-Tedc	Н
205	3-0H-Myr	3-0H-Tedc	Dco	3-ODdc-Tedc	Н
206	3-OH-Myr	3-0H-Tedc	Lau	3-ODdc-Tedc	Н
207	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Myr	3-ODdc-Tedc	Н
208	3-OH-Myr	3-0H-Tedc	Pal	3-ODdc-Tedc	Н
209	3-OH-Myr	3-0H-Tedc	Ste	3-ODdc-Tedc	Н
210	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Eicn	3-ODdc-Tedc	Н
211	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-OAc-Byr	3-OBu-Bu	Н
212	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-OByr-Hxn	3-ОНх-Нх	Н
213	3-0H-Myr	3-0H-Tedc	3-OHxn-Octo	3-00c-0c	Н
214	3-0H-Myr	3-0H-Tedc	3-OOcto-Dco	3-ODc-Dc	Н

25

215	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-ODco-Lau	3-ODdc-Ddc	Н
216	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OLau-Myr	3-ODdc-Tedc	Н
217	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-OH-Myr	3-ODdc-Tedc	Н
218	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OLau-Myr	3-OH-Tedc	Н
219	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Н
220	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Н
221	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OH-Myr	3-(=0)-Tedc	Н
222	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	2-F-3-OLau-Myr	2-F-3-ODdc-Tedc	Н
223	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	2-F-3-OH-Dco	3-ODdc-Tedc	Н
224	3-0H-Myr .	3-OH-Tedc	2-Cl-3-OLau-Myr	2-C1-3-ODdc-Tedc	Н
225	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OLau-Myr	3-OTedc-Ddc	Н
226	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OLau-Myr	3-OTedc-Ddc	Н
227	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-0Lau-Lau	3-ODdc-Tedc	Н
228	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	3-OMyr-Pal	3-OHdc-Hdc	Н
229	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OPal-Ste	3-00dc-0dc	Н
230	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	3-OSte-Eicn	3-0Ei-Ei	Н
231	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Fo	3-OTedc-Tedc	Н
232	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Ac	3-OTedc-Tedc	Н
233	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Prn	3-OTedc-Tedc	Н
234	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Byr	3-OTedc-Tedc	Н
235	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Val	3-OTedc-Tedc	Н
236	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Hxn	3-OTedc-Tedc	Н
237	3 -OH-My ${f r}$	3-OH-Tedc	Fo	3-OTedc-Ddc	Н
238	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Ac	3-OTedc-Ddc	Н
239	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Prn	3-OTedc-Ddc	Н
240	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Byr	3-OTedc-Ddc	Н
241	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Val	3-OTedc-Ddc	Н
242	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Hxn	3-OTedc-Ddc	Н
243	3-OH-Myr	3-OH-Tedc	Fo	3-ODdc-Ddc	Н

26

244	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Ac	3-ODdc-Ddc	Н
245	3-0H-Myr	3-0H-Tedc	Prn	3-ODdc-Ddc	Н
246	3-0H-Myr	3-OH-Tedc	Byr	3-ODdc-Ddc	Н
247	3-0H-Myr	3-0H-Tedc	Val	3-ODdc-Ddc	Н
248	3-0H-Myr	3-0H-Tedc	Hxn	3-ODdc-Ddc	Н
249	Myr	Tedc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
250	Myr	Tedc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
251	Myr	Tedc	Fo	3-OTedc-Tedc	OMe
252	Myr	Tedc	Fo	3-0Tedc-Tedc	ОН
253	Myr	Tedc	Fo	3-ODc-Dc	OMe
254	Myr	Tedc	Fo	3-ODc-Dc	ОН
255	Myr	Tedc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
256	Myr	Tedc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
257	Myr	Tedc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
258	Myr	Tedc	Fo	3-OTedc-Dc	ОН
259	Myr	Tedc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
260	Myr	Tedc	Ac	3-ODc-Tedc	ОН
261	Myr	Tedc	Ac	3-OTedc-Tedc	OMe
262	Myr	Tedc	Ac	3-OTedc-Tedc	OH
263	Myr	Tedc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
264	Myr	Tedc	Ac	3-ODc-Dc	ОН
265	Myr	Tedc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
266	Myr	Tedc	Ac	3-ODdc-Dc	OH
267	Myr	Tedc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
268	Myr	Tedc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН
269	Myr	Ddc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
270	Myr	Ddc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
271	Myr	Ddc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
272	Myr	Ddc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН

27

273	Myr	Ddc	Fo	3-OTedc-Tedc	OMe
274	Myr	Ddc	Fo	3-OTedc-Tedc	ОН
275	Myr	Ddc	Fo	3-ODc-Dc	OMe
276	Myr	Ddc	Fo	3-ODc-Dc	ОН
277	Myr	Ddc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
278	Myr	Ddc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
279	Myr	Ddc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
280	Myr	Ddc	Fo	3-OTedc-Dc	ОН
281	Myr	Ddc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
282	Myr	Ddc	Ac	3-ODc-Tedc	ОН
283	Myr	Ddc	, Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
284	Myr	Ddc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
285	Myr	Ddc	Ac	3-OTedc-Tedc	OMe
286	Myr	Ddc	Ac	3-OTedc-Tedc	ОН
287	Myr	Ddc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
288	Myr	Ddc	Ac	3-ODc-Dc	ОН
289	Myr	Ddc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
290	Myr	Ddc	Ac	3-ODdc-Dc	ОН
291	Myr	Ddc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
292	Myr	Ddc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН
293	Myr	Dc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
294	Myr	Dc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
295	Myr	Dc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
296	Myr	Dc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
297	Myr	Dc	Fo	3-OTedc-Tedc	OMe
298	Myr	Dc	Fo	3-OTedc-Tedc	ОН
299	Myr	Dc	Fo	3-ODc-Dc	OMe
300	Myr	Dc	Fo	3-ODc-Dc	ОН
301	Myr	Dc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe

.

302	Myr	Dc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
303	Myr	Dc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
304	Myr	Dc	Fo	3-OTedc-Dc	ОН
305	Myr	Dc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
306	Myr	Dc	Ac	3-ODc-Tedc	ОН
307	Myr	Dc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
308	Myr	Dc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
309	Myr	Dc	Ac	3-0Tedc-Tedc	OMe
310	Myr	Dc	Ac	3-OTedc-Tedc	ОН
311	Myr	Dc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
312	Myr	Dc	Ac	3-ODc-Dc	ОН
313	Myr	Dc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
314	Myr	Dc	Ac	3-ODdc-Dc	ОН
315	Myr	Dc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
316	Myr	Dc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН
317	Lau	Tedc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
318	Lau	Tedc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
319	Lau .	Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
320	Lau	Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
321	Lau	Tedc	Fo	3-OTedc-Tedc	OMe
322	Lau	Tedc	Fo	3-OTedc-Tedc	ОН
323	Lau	Tedc	Fo	3-ODc-Dc	OMe
324	Lau	Tedc	Fo	3-ODc-Dc	ОН
325	Lau	Tedc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
326	Lau	Tedc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
327	Lau	Tedc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
328	Lau	Tedc	Fo	3-OTedc-Dc	ОН
329	Lau	Tedc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
330	Lau	Tedc	Ac	3-ODc-Tedc	ОН

28

331	Lau	Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
332	Lau	Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
333	Lau	Tedc	Ac	3-OTedc-Tedc	OMe
334	Lau	Tedc	Ac	3-OTedc-Tedc	ОН
335	Lau	Tedc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
336	Lau	Tedc	Ac	3-ODc-Dc	ОН
337	Lau	Tedc	Ac	3-ODdc-Dc	0Me
338	Lau	Tedc	Ac	3-ODdc-Dc	ОН
339	Lau	Tedc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
340	Lau	Tedc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН
341	Lau	Ddc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
342	Lau	Ddc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
343	Lau	Ddc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
344	Lau	Ddc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
345	Lau	Ddc	Fo	3-OTedc-Tedc	OMe
346	Lau	Ddc	Fo	3-OTedc-Tedc	ОН
347	Lau	Ddc	Fo	3-ODc-Dc	OMe
348	Lau	Ddc	Fo	3-ODc-Dc	ОН
349	Lau	Ddc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
350	Lau	Ddc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
351	Lau	Ddc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
352	Lau	Ddc	Fo	3-OTedc-Dc	ОН
353	Lau	Ddc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
354	Lau	Ddc	Ac	3-ODc-Tedc	ОН
355	Lau	Ddc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
356	Lau	Ddc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
357	Lau	Ddc	Ac	3-OTedc-Tedc	OMe
358	Lau	Ddc	Ac	3-OTedc-Tedc	ОН
359	Lau	Ddc	Ac	3-0Dc-Dc	OMe

29

30

360	Lau	Ddc	Ac	3-ODc-Dc	ОН
361	Lau	Ddc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
362	Lau	Ddc	Ac	3-ODdc-Dc	ОН
363	Lau	Ddc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
364	Lau	Ddc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН
365	Lau	Dc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
366	Lau	Dc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
367	Lau	Dc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
368	Lau	Dc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
369	Lau	Dc	Fo	3-OTedc-Tedc	OMe
370	Lau	Dc	Fo	3-OTedc-Tedc	ОН
371	Lau	Dc	Fo	3-ODc-Dc	OMe
372	Lau	Dc	Fo	3-ODc-Dc	ОН
373	Lau	Dc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
374	Lau	Dc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
375	Lau	Dc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
376	Lau	Dc	Fo	3-OTedc-Dc	ОН
377	Lau	Dc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
378	Lau	Dc	Ac	3-ODc-Tedc	ОН
379	Lau	Dc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОМе
380	Lau	Dc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
381	Lau	Dc	Ac	3-OTedc-Tedc	OMe
382	Lau	Dc	Ac	3-OTedc-Tedc	ОН
383	Lau	Dc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
384	Lau	Dc	Ac	3-ODc-Dc	ОН
385	Lau	Dc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
386	Lau	Dc	Ac	3-ODdc-Dc	ОН
387	Lau	Dc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
388	Lau	Dc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН

389 3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
390 3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
391 3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(5-0dce)-Dc	OMe
392 3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(5-0dce)-Tedc	OMe
393 3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
394 3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Tedce) -Tedc	OMe
395 3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Eie)-Dc	OMe
396 3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Eie)-Tedc	OMe
397 3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
398 3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
399 3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(5-0dce)-Dc	OMe
400 3-(=0)-Myr	3-0H-Ddc	Ac	1-0-(5-0dce)-Tedc	OMe
401 3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
402 3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
403 3-(=0)-Myr	3-0H-Ddc	Ac	1-0-(7-Eie)-Dc	OMe
404 3-(=0)-Myr	3-0H-Ddc	Ac	1-0-(7-Eie)-Tedc	OMe
405 3-(=0)-Myr	3-0H-Tedc	Fo	1-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
406 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
407 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(5-0dce)-Dc	OMe
408 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(5-0dce) -Tedc	OMe
409 3-(=0)-Myr	3-0H-Tedc	Fo	1-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
410 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
411 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(7-Eie)-Dc	OMe
412 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(7-Eie)-Tedc	OMe
413 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
414 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
415 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-Odce)-Dc	OMe
416 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-0dce)-Tedc	OMe
417 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(7-Tedce)-Dc	OMe

418	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(7-Tedce) -Tedc	OMe
419	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(7-Eie)-Dc	OMe
420	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(7-Eie)-Tedc	OMe
421	3-(=0)-Myr	3-0H-Ddc	Fo	1-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
422	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
423	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(5-0dce)-Dc	ОН
424	3-(=0)-Myr	3-0H-Ddc	Fo	1-0-(5-0dce)-Tedc	ОН
425	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
426	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
427	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Eie)-Dc	ОН
428	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Eie)-Tedc	ОН
429	3-(=0)-Myr	3-0H-Ddc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
430	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
431	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(5-0dce)-Dc	ОН
432	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(5-0dce)-Tedc	ОН
433	3-(=0)-Myr	3-0H-Ddc	Ac	1-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
434	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
435	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(7-Eie)-Dc	ОН
436	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(7-Eie)-Tedc	ОН
437	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
438	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
439	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(5-0dce)-Dc	ОН
440	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(5-0dce)-Tedc	ОН
441	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(7-Tedce) -Dc	ОН
442	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
443	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(7-Eie)-Dc	ОН
444	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(7-Eie)-Tedc	ОН
445	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
446	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН

447	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-0dce)-Dc	ОН
448	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-0dce)-Tedc	ОН
449	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
450	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
451	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(7-Eie)-Dc	ОН
452	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(7-Eie)-Tedc	ОН
453	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(5-Ddce)-Dc	F
454	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(5-Ddce)-Tedc	F
455	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(5-0dce)-Dc	F
456	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(5-0dce)-Tedc	F
457	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Tedce)-Dc	F
458	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Tedce)-Tedc	F
459	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Eie)-Dc	F
460	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Eie)-Tedc	F
461	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Dc	F
462	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Tedc	F
463	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(5-0dce)-Dc	F
464	3-(=0)-Myr	3-0H-Ddc	Ac	1-0-(5-0dce)-Tedc	F
465	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(7-Tedce)-Dc	F
466	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(7-Tedce)-Tedc	F
467	3-(=0)-Myr	3-0H-Ddc	Ac	1-0-(7-Eie)-Dc	F
468	3-(=0)-Myr	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(7-Eie)-Tedc	F
469	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(5-Ddce)-Dc	F
470	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1- 0- (5- D dce)- T edc	F
471	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(5-0dce)-Dc	F
472	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(5-0dce)-Tedc	F
473	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(7-Tedce)-Dc	F
474	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(7-Tedce)-Tedc	F
475	3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(7-Eie)-Dc	F

34

476 3-(=0)	-Myr 3	B-OH-Tedc	Fo	1-0-(7-Eie)-Tedc	F
477 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Dc	F
478 3-(=0)	-Myr 3	B-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Tedc	F
479 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-0dce)-Dc	F
480 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-0dce)-Tedc	F
481 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(7-Tedce)-Dc	F
482 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(7-Tedce)-Tedc	F
483 3-(=0)	-Myr 3	B-OH-Tedc	Ac	1-0-(7-Eie)-Dc	F
484 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(7-Eie)-Tedc	F
485 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(5-Ddce)-Dc	Н
486 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(5-Ddce)-Tedc	Н
487 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(5-Odce)-Dc	Н
488 3-(=0)	-Myr 3	B-OH-Ddc	Fo	1-0-(5-0dce)-Tedc	Н
489 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Tedce)-Dc	Н
490 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Tedce)-Tedc	Н
491 3-(=0)	-Myr 3	B-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Eie)-Dc	Н
492 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Ddc	Fo	1-0-(7-Eie)-Tedc	Н
493 3-(=0)	-Myr 3	B-OH-Ddc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Dc	Н
494 3-(=0)	-Myr 3	B-OH-Ddc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Tedc	Н
495 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(5-0dce)-Dc	Н
496 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(5-0dce)-Tedc	Н
497 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(7-Tedce)-Dc	Н
498 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Ddc	Ac	1-0- (7-Tedce) -Tedc	Н
499 3-(=0)-	-Myr 3	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(7-Eie)-Dc	Н
500 3-(=0)	-Myr 3	3-OH-Ddc	Ac	1-0-(7-Eie)-Tedc	Н
501 3-(=0)	-Myr 3	B-OH-Tedc	Fo	1-0-(5-Ddce)-Dc	Н
502 3-(=0)	-Myr 3	3-0H-Tedc	Fo	1-0-(5-Ddce)-Tedc	Н
503 3-(=0)	-Myr 3	8-0H-Tedc	Fo	1-0-(5-0dce)-Dc	Н
504 3-(=0)	-Myr 3	B-OH-Tedc	Fo	1-0-(5-0dce)-Tedc	Н

		00		
505 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(7-Tedce)-Dc	Н
506 3-(=0)-Myr	3 - 0H-Tedc	Fo	1-0-(7-Tedce) -Tedc	Н
507 3-(=0)-Myr	3- 0 H-Tedc	Fo	1-0-(7-Eie)-Dc	Н
508 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Fo	1-0-(7-Eie)-Tedc	Н
509 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Dc	Н
510 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-Ddce)-Tedc	Н
511 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-0dce)-Dc	Н
512 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(5-0dce)-Tedc	Н
513 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(7-Tedce)-Dc	Н
514 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(7-Tedce)-Tedc	Н
515 3-(=0)-Myr	3 - 0H-Tedc	Ac	1-0-(7-Eie)-Dc	Н
516 3-(=0)-Myr	3-OH-Tedc	Ac	1-0-(7-Eie)-Tedc	Н
517 Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
518 Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
519 Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
520 Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
521 Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
522 Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
523 Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
524 Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
525 Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
526 Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
527 Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
528 Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Tedc	OMe
529 Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
530 Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
531 Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce) -Tedc	ОН
532 . Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
533 Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce) <i>-</i> Dc	ОН

534	Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
535	Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
536	Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
537	Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
538	Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
539	Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
540	Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
541	Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
542	Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
543	Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
544	Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce) -Tedc	OMe
545	Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
546	Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
547	Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
548	Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
549	Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
550	Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
551	Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
552	Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
553	Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
554	Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
555	Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
556	Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
557	Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
558	Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
559	Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
560	Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce) -Tdce	OMe
561	Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
562	Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe

563	Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Tedc	ОН
564	Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Tedc	OMe
565	Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
566	Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
. 567	Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OH
568	Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ome
569	Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
570	Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
571	Myr	Tedc	· Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
572	Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
573	${ t Myr}$	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
574	Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
575	Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
576	Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce) -Tedc	OMe
577	Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
578	Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Dc	OMe
579	Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
580	Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	OMe
581	Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
582	Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
583	Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
584	Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
585	Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
586	Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
587	Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
588	Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
589	Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
590	Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
591	Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН

592	Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
593	Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
594	Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
595	Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
596	Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
597	Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
598	Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
599	Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Tedc	ОН
600	Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Tedc	OMe
601	Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
602	Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
603	Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
604	Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
605	Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
606	Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
607	Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
608	Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
609	Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
610	Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
611	Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
612	Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
613	Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce) -Dc	ОН
614	Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
615	Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
616	Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
617	Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
618	Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
619	Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce) -Tedc	ОН
620	Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe

621	Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
622	Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
623	Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
624	Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
625	Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
626	Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
627	Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
628	Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
629	Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
630	Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
631	Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
632	Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
633	Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Dc	ОН
634	Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
635	Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Tedc	ОН
636	Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Tedc	OMe
637	Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
638	Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
639	Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
640	Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
641	Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
642	Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Dc	OMe
643	Myr	Ddc ·	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
644	Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
645	Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
646	Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
647	Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
648	Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
649	Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН

40

650	Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
651	Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	OH
652	Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	OMe
653	Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
654	Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
655	Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
656	Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
657	Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
658	Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
659	Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
660	Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
661	Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
662	Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
663	Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
664	Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
665	Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
666	Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
667	Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce) -Tdce	ОН
668	${ t Myr}$	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
669	Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
670	Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
671	Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Tedc	ОН
672	Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Tedc	OMe
673	Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
674	Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
675	Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
676	Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
677	Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
678	Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe

PCT/JP01/03005

679	Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	ОН
680	Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
681	Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
682	Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
683	Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
684	Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
685	Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
686	Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
687	Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
688	Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
689	Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
690	Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
691	Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
692	Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
693	Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
694	Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОМе
695	Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
696	Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
697	Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
698	Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
699	Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
700	Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
701	Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
702	Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
703	Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
704	Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce) -Tdce	OMe
705	Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
706	Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
707	Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН

42

708	Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Tedc	OMe
709	Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
710	Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
711	Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
712	Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
713	Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
714	Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
715	Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
716	Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
717	Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
718	Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
719	Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
720	Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
721	Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
722	Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
723	Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
724	Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
725	Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
726	Myr	Dc	Λc	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
727	Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
728	Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
729	Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
730	Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
731	Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
732	Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
733	Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
734	Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
735	Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
736	Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe

			4	43
737	Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc OH
738	Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc OMe
739	Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce OH
740	Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce OMe
741	Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc OH
742	Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc OMe
743	Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc OH
744	Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc OMe
745	Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc OH
746	Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc OMe
747	Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc OH
748	Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc OMe
749	Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc OH
750	Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc OMe
751	Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc OH
752	Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc OMe
753	Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc OH
754	Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc OMe
755	Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc OH
756	Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc OMe
757	Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc OH
758	Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc OMe
759	Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce) -Tedc OH
760	Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc OMe
761	Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc OH
762	Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc OMe
763	Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc OH
764	Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc OMe

765 Lau Tedc Fo 3-0-(7-Hdce)-Dc OH

PCT/JP01/03005

44

766	Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
767	Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
768	Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
769	Lau -	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
770	Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
771	Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
772	Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
773	Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
774	Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
775	Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
776	Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
777	Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
778	Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
779	Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
780	Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
781	Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
782	Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	· OMe
783	Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
784	Lau	Tedc	. Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
785	Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
786	Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
787	Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Tedc	ОН
788	Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Tedc	OMe
789	Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OH
790	Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
791	Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
792	Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
793	Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
794	Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe

795	Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
796	Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	OMe
797	Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
798	Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
799	Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
800	Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
801	Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
802	Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
803	Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
804	Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
805	Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
806	Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
807	Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
808	Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
809	Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
810	Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
811	Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
812	Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
813	Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
814	Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Dc	OMe
815	Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
816	Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
817	Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
818	Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
819	Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
820	Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
821	Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
822	Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
823	Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	ОН

824	Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	OMe
825	Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
826	Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
827	Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
828	Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
829	Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
830	Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
831	Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
832	Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
833	Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
834	Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
835	Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
836	Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce) -Tedc	OMe
837	Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
838	Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
839	Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
840	Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
841	Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
842	Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
843	Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
844	Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
845	Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
846	Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
847	Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce) -Tdce	ОН
848	Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
849	Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Dc	ОН
850	Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
851	Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Tedc	ОН
852	Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Tedc	OMe

46

47

853	Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
854	Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
855	Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
856	Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
857	Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
858	Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Dc	OMe
859	Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
860	Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Tedc	OMe
861	Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
862	Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
863	Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
864	Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
865	Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
866	Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
867	Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
868	Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
869	Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
870	Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
871	Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
872	Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
873	Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
874	Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
875	Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
876	Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
877	Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
878	Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
879	Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
880	Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
881	Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН

882	Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
.883	Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
884	Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
885	Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
886	Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
887	Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
888	Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
889	Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
890	Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
891	Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce) -Tedc	ОН
892	Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОМе
893	Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
894	Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
895	Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	ОН
896	Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	ОМе
897	Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
898	Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
899	Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
900	Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
901	Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
902	Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
903	Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce) - Tedc	ОН
904	Lau	De	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
905	Lau	De	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
906	Lau	Dc	. Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
907	Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
908	Lau .	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
909	Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
910	Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe

•

WO 01/77133

PCT/JP01/03005

	, *				
911	Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
912	Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
913	Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
914	Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
915	Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
916	Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
917	Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
918	Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
919	Lau	Dc	Ac	3 - 0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
920	Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
921	Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
922	Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
923	Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
924	Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
925	Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
926	Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
927	Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
928	Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
929	Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
930	Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
931	Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Tedc	ОН
932	Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Tedc	OMe
933	Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
934	Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
935	Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
936	Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
937	Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
938	Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
939	Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН

940	Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
941	Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
942	Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
943	Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
944	Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
945	Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
946	Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
947	Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
948	Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
949	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
950	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОМе
951	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
952	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce) -Tedc	OMe
953	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce) -Dc	ОН
954	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
955	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
956	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce) -Tdce	OMe
957	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
958	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
959	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0- (5-Tedce) -Tedc	ОН
960	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
961	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
962	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
963	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
964	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
965	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
966	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
967	$^{\circ}$ 2, 2-(F) $_{2}$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
968	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0- (6-Tedce) -Tedc	OMe

969	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
970	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
971	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
972	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
973	$2,2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
974	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
975	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
976	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
977	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
978	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
979	$2,2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
980	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
981	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
982	$2,2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
983	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
984	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
985	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
986	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
987	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OH
988	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
989	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce) -Dc	ОН
990	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
991	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
992	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
993	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
994	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
995	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OH
996	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Tedc	OMe
997	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН

998	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
999	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1000	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce) -Tedc	OMe
1001	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1002	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Dc	OMe
1003	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Tedc	ОН
1004	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Tedc	OMe
1005	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1006	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Ac .	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1007	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
1008	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1009	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1010	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1011	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
1012	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	OMe
1013	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1014	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1015	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1016	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1017	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1018	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1019	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1020	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1021	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1022	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1023	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1024	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce) -Tedc	ОМе
1025	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1026	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe

1027	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce) -Tdce	ОН
1028	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
1029	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1030	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1031	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Tedc	ОН
1032	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0- (5-Tedce) -Tedc	OMe
1033	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1034	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОМе
1035	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1036	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1037	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1038	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1039	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	ОН
1040	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	OMe
1041	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1042	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1043	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce) -Tedc	ОН
1044	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1045	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1046	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1047	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
1048	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce) -Tedc	OMe
1049	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1050	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1051	2, 2-(F) ₂ -Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1052	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1053	2,2-(F) ₂ -Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1054	2, 2-(F) ₂ -Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1055	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН

1056	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1057	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1058	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1059	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1060	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1061	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1062	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1063	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
1064	$2,2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
1065	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1066	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1067	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
1068	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0- (5-Tedce) -Tedc	OMe
1069	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1070	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1071	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1072	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1073	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1074	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1075	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Tedc	ОН
1076	$2,2$ -(F) $_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0- (6-Tedce) -Tedc	OMe
1077	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1078	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1079	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
1080	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1081	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1082	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОМе
1083	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
1084	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ÓМе

1085	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1086	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1087	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1088	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1089	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1090	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1091	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1092	2 , 2 -(F) $_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1093	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1094	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1095	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1096	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1097	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1098	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1099	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
1100	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
1101	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1102	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1103	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
1104	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Tedc	OMe
1105	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1106	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1107	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1108	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1109	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OH
1110	2,2-(F) ₂ -Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1111	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
1112	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
1113	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН

1114	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe	
1115	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН	
1116	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe	
1117	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН	
1118	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe	
1119	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН	
1120	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe	
1121	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН	
1122	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe	
1123	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OH	
1124	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe	
1125	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН	
1126	2 , $2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe	
1127	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН	
1128	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe	
1129	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН	
1130	2 , $2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe	
1131	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН	
1132	2 , $2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce) -Tedc	OMe	
1133	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OH	
1134	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe	
1135	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН	
1136	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe	
1137	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН	
1138	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe	
1139	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-0- (5-Tedce) -Tedc	ОН	
1140	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0- (5-Tedce) -Tedc	OMe	
1141	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН	
1142	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe	

1143	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1144	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1145	$2; 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1146	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1147	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
1148	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
1149	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1150	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1151	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
1152	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1153	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1154	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1155	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
1156	2 , 2 - $(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-0- (7-Tedce) -Tedc	OMe
1157	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Dc	Λc	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1158	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1159	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1160	2 , 2 - $(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1161	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1162	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1163	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1164	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1165	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1166	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1167	2 , 2 – $^{(F)}_{2}$ –Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1168	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1169	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1170	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1171	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0- (5-Tdce) -Tdce	ОН

1172	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
1173	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1174	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1175	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
1176	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0- (5-Tedce) -Tedc	OMe
1177	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1178	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1179	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1180	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1181	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1182	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1183	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0- (6-Tedce) -Tedc	ОН
1184	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	OMe
1185	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1186	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1187	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce) -Tedc	ОН
1188	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce) -Tedc	OMe
1189	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1190	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1191	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
1192	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
1193	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1194	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1195	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1196	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1197	2 , 2 -(F) $_2$ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1198	2,2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1199	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1200	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe

1201	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OH
1202	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1203	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1204	2 , 2 – $(F)_2$ –Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1205	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1206	2 , 2 – $^{(F)}_{2}$ –Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОМе
1207	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
1208	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce) -Tdce	ОМе
1209	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1210	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОМе
1211	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
1212	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
1213	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1214	2 , 2 – $(F)_2$ –Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1215	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce) -Tedc	ОН
1216	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1217	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Dc	ОН
1218	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1219	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
1220	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Tedc	OMe
1221	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1222	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1223	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
1224	2, 2-(F) $_2$ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce) -Tedc	OMe
1225	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1226	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1227	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	. Ac	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
1228	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
1229	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН

1230	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1231	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1232	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1233	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1234	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1235	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OH
1236	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1237	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1238	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОМе
1239	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1240	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1241	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1242	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОМе
1243	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
1244	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
1245	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1246	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1247	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0- (5-Tedce) -Tedc	ОН
1248	2 , 2 –(F) $_2$ –Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
1249	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce) -Dc	ОН
1250	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1251	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1252	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce) -Tedc	OMe
1253	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1254	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1255	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	ОН
1256	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	OMe
1257	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1258	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe

1259	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
1260	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce) -Tedc	OMe
1261	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1262	2, $2-(F)_2$ –Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce) -Dc	OMe
1263	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
1264	2, $2-(F)_2$ –Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce) -Tedc	OMe
1265	2, $2-(F)_2$ –Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1266	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1267	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1268	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1269	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1270	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1271	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1272	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1273	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1274	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1275	2, 2–(F) $_2$ –Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OH
1276	2, 2–(F) $_2$ –Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1277	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1278	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1279	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
1280	2, 2–(F) $_2$ –Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
1281	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1282	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1283	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Tedc	ОН
1284	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
1285	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1286	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1287	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН

62

1288	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce) -Tedc	OMe
1289	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	, OH
1290	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1291	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
1292	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
1293	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce) -Dc	ОН
1294	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1295	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce) -Tedc	ОН
1296	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc .	Ac	3-0-(6-Pdce) -Tedc	OMe
1297	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1298	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1299	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
1300	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
1301	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce) -Dc	ОН
1302	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1303	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce) -Tedc	ОН
1304	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1305	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1306	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1307	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1308	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce) -Tedc	OMe
1309	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1310	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1311	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1312	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1313	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1314	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1315	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
1316	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce) -Tdce	OMe

1317	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1318	2 , 2 – $^{(F)}_{2}$ –Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1319	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Tedc	ОН
1320	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Tedc	OMe
1321	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1322	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1323	2 , $2-(F)_2$ -Lau	Dc	Fo	3-0- (6-Tdce) -Tedc	ОН
1324	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce) -Tedc	OMe
1325	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1326	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1327	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	ОН
1328	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	OMe
1329	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1330	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1331	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce) -Tedc	ОН
1332	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce) -Tedc	OMe
1333	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1334	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1335	2 , 2 – $(F)_2$ –Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
1336	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0- (7-Tedce) -Tedc	OMe
1337	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce) -Dc	ОН
1338	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1339	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1340	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1341	2 , 2 – $^{(F)}_{2}$ –Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1342	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1343	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1344	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1345	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН

1346	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1347	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1348	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1349	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1350	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1351	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
1352	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce) -Tdce	OMe
1353	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1354	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1355	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
1356	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
1357	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1358	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1359	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1360	2, $2-(F)_2$ -Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce) -Tedc	OMe
1361	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1362	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1363	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
1364	2 , $2-(F)_2$ -Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
1365	2 , $2-(F)_2$ -Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1366	2 , $2-(F)_2$ -Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1367	2 , $2-(F)_2$ -Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
1368	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1369	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1370	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1371	2, 2–(F) $_2$ –Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
1372	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	OMe
1373	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1374	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe

$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$						
1377 2, 2-(F) ₂ -Lau Dc Ac 3-O-(7-Hdce)-Dc OMe 1378 2, 2-(F) ₂ -Lau Dc Ac 3-O-(7-Hdce)-Dc OMe 1379 2, 2-(F) ₂ -Lau Dc Ac 3-O-(7-Hdce)-Tedc OH 1380 2, 2-(F) ₂ -Lau Dc Ac 3-O-(7-Hdce)-Tedc OMe 1381 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Ddce)-Dc OMe 1382 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Ddce)-Dc OMe 1383 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Ddce)-Tedc OMe 1384 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Ddce)-Tedc OMe 1385 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Ddce)-Tedc OMe 1386 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tdce)-Dc OMe 1387 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tdce)-Dc OMe 1388 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tdce)-Dc OMe 1389 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tdce)-Dc OMe 1390 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tdce)-Dc OMe 1391 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tedce)-Dc OMe 1392 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tedce)-Dc OMe 1393 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tedce)-Dc OMe 1394 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Tedc OMe 1395 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Dc OMe 1396 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Dc OMe 1397 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Dc OMe 1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Dc OMe 1391 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Dc OMe 1392 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Dc OMe 1393 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Dc OMe 1394 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Tedc OMe 1395 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Tedc OMe 1396 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Dc OMe 1397 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Dc OMe 1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tedce)-Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tedce)-Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tedce)-Dc OMe 1300 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tedce)-Dc OMe 1301 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tedce)-Dc OMe 1302 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tedce)-Dc OMe	1375	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1378 2, 2-(F) ₂ -Lau Dc Ac 3-0-(7-Hdce)-Dc OMe 1379 2, 2-(F) ₂ -Lau Dc Ac 3-0-(7-Hdce)-Tedc OH 1380 2, 2-(F) ₂ -Lau Dc Ac 3-0-(7-Hdce)-Tedc OMe 1381 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce)-Dc OMe 1382 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce)-Dc OMe 1383 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce)-Tedc OMe 1384 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce)-Tedc OMe 1385 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce)-Tedc OMe 1386 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce)-Dc OMe 1387 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce)-Dc OMe 1388 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce)-Dc OMe 1388 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce)-Tdce OMe 1389 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce)-Tdce OMe 1390 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Dc OMe 1391 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Dc OMe 1392 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Dc OMe 1393 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Tedc OH 1394 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Dc OMe 1395 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Dc OMe 1396 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Dc OMe 1397 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Tedc OMe 1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OMe 1300 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OMe	1376	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1379 2, 2-(F) ₂ -Lau Dc Ac 3-0-(7-Hdce)-Tedc OH 1380 2, 2-(F) ₂ -Lau Dc Ac 3-0-(7-Hdce)-Tedc OMe 1381 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce)-Dc OH 1382 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce)-Dc OMe 1383 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce)-Tedc OMe 1384 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce)-Tedc OH 1385 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce)-Tedc OMe 1385 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce)-Dc OMe 1386 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce)-Dc OMe 1387 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce)-Dc OMe 1388 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce)-Tdce OH 1389 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce)-Dc OMe 1389 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Dc OMe 1391 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Dc OMe 1392 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Tedc OH 1392 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Tedc OMe 1393 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Tedc OMe 1394 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Dc OMe 1395 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Dc OMe 1396 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Tedc OH 1396 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Tedc OH 1397 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Tedc OH 1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OH 1400 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc O	1377	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1380 2, 2-(F) ₂ -Lau Dc Ac 3-0-(7-Hdce) -Tedc OMe 1381 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce) -Dc OH 1382 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce) -Dc OMe 1383 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce) -Tedc OH 1384 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce) -Tedc OMe 1385 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce) -Tedc OMe 1386 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce) -Dc OMe 1387 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce) -Dc OMe 1388 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce) -Dc OMe 1389 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce) -Dc OMe 1390 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) -Dc OMe 1391 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) -Dc OMe 1392 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) -Tedc OMe 1393 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) -Tedc OMe 1394 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Dc OMe 1395 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Dc OMe 1396 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Dc OMe 1397 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Tedc OMe 1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Tedc OMe 1397 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Dc OMe 1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) -Dc OMe 1400 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) -Dc OMe	1378	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1381 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce) -Dc OH 1382 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce) -Dc OMe 1383 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce) -Tedc OH 1384 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Ddce) -Tedc OMe 1385 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce) -Dc OH 1386 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce) -Dc OH 1387 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce) -Tdce OH 1388 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) -Tdce OH 1389 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) -Dc OH 1390 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) -Dc OH 1391 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) -Tedc OH 1392 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Dc OH 1393	1379	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1382	1380	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1383	1381	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1384 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Ddce)-Tedc OMe 1385 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tdce)-Dc OH 1386 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tdce)-Dc OMe 1387 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tdce)-Tdce OH 1388 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tdce)-Tdce OMe 1389 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tdce)-Tdce OMe 1390 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tedce)-Dc OMe 1391 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tedce)-Dc OMe 1392 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tedce)-Tedc OMe 1393 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tedce)-Tedc OMe 1394 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Dc OMe 1395 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Dc OMe 1396 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Tedc OH 1397 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Tedc OMe 1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tedce)-Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tedce)-Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tedce)-Dc OMe 1400 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tedce)-Tedc OH 1400 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tedce)-Tedc OMe 1401 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tedce)-Tedc OMe 1402 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tedce)-Tedc OMe	1382	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1385 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tdce)-Dc OH 1386 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tdce)-Dc OMe 1387 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tdce)-Tdce OH 1388 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tdce)-Dc OMe 1389 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tedce)-Dc OH 1390 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tedce)-Tedc OH 1391 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tedce)-Tedc OH 1392 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(5-Tedce)-Tedc OMe 1393 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Tedc OMe 1394 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Dc OMe 1395 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tdce)-Tedc OH 1396 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-O-(6-Tedce)-Dc OH 1398 3-(=0)-Myr<	1383	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1386	1384	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1387 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce)-Tdce OH 1388 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce)-Tdce OMe 1389 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Dc OH 1390 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Dc OMe 1391 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Tedc OH 1392 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Tedc OMe 1393 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Dc OH 1394 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Dc OMe 1395 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Tedc OH 1396 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OH 1397 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OH 1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OH 1400 3-(=0)-Myr </td <td>1385</td> <td>3-(=0)-Myr</td> <td>Tedc</td> <td>Fo</td> <td>3-0-(5-Tdce)-Dc</td> <td>ОН</td>	1385	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1388 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tdce)-Tdce OMe 1389 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Dc OH 1390 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Tedc OH 1391 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Tedc OH 1392 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Tedc OMe 1393 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Dc OH 1394 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Dc OMe 1395 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Tedc OH 1396 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OH 1397 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OH 1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OH 1400 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OH 1401 3-(=0)-Myr	1386	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1389 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) -Dc OH 1390 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) -Dc OMe 1391 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) -Tedc OH 1392 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) -Tedc OMe 1393 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Dc OH 1394 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Dc OMe 1395 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Tedc OH 1396 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) -Dc OHe 1397 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) -Dc OHe 1398 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) -Tedc OH 1400 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) -Tedc OHe 1401 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) -Dc OHe 1402<	1387	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce) -Tdce	ОН
1390 3-(=0) - Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) - Dc OMe 1391 3-(=0) - Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) - Tedc OH 1392 3-(=0) - Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) - Tedc OMe 1393 3-(=0) - Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) - Dc OH 1394 3-(=0) - Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) - Dc OMe 1395 3-(=0) - Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) - Tedc OH 1396 3-(=0) - Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) - Dc OHe 1397 3-(=0) - Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) - Dc OHe 1398 3-(=0) - Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) - Tedc OH 1400 3-(=0) - Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) - Tedc OHe 1401 3-(=0) - Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) - Tedc OHe 1402 3-(=0) - Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) - Dc OHe	1388	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce) -Tdce	OMe
1391 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Tedc OH 1392 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce)-Tedc OMe 1393 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Dc OH 1394 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Dc OMe 1395 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Tedc OH 1396 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Tedc OMe 1397 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OMe 1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OMe 1400 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OMe 1401 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OMe 1402 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OMe	1389	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1392 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(5-Tedce) -Tedc OMe 1393 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Dc OH 1394 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Dc OMe 1395 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce) -Tedc OH 1396 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) -Tedc OMe 1397 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) -Dc OH 1398 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) -Tedc OH 1400 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce) -Tedc OMe 1401 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce) -Dc OH 1402 3-(=0) -Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce) -Dc OMe	1390	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1393 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Dc OH 1394 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Dc OMe 1395 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Tedc OH 1396 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Tedc OMe 1397 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OH 1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OH 1400 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OMe 1401 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OH 1402 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OMe	1391	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Tedc	ОН
1394 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Dc OMe 1395 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Tedc OH 1396 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Tedc OMe 1397 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OH 1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OH 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OH 1400 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OH 1401 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OH 1402 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OMe	1392	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Tedc	OMe
1395 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Tedc OH 1396 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Tedc OMe 1397 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OH 1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OH 1400 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OH 1401 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OMe 1402 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OMe	1393	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1396 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tdce)-Tedc OMe 1397 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OH 1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OH 1400 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OH 1401 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OMe 1402 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OMe	1394	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1397 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OH 1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OH 1400 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OMe 1401 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OH 1402 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OMe	1395	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1398 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Dc OMe 1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OH 1400 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OMe 1401 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OH 1402 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OMe	1396	3 - (=0) - Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1399 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OH 1400 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OMe 1401 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OH 1402 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OMe	1397	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1400 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Tedce)-Tedc OMe 1401 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OH 1402 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OMe	1398	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1401 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OH 1402 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OMe	1399	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	ОН
1402 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Dc OMe	1400	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
	1401	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1403 3-(=0)-Myr Tedc Fo 3-0-(6-Pdce)-Tedc OH	1402	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
	1403	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН

1404	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1405	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1406	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1407	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
1408	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
1409	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1410	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1411	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1412	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1413	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1414	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1415	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1416	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОМе
1417	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1418	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1419	3-(=0)-Myr	Tedc	· Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1420	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1421	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1422	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1423	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
1424	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
1425	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Dc	ОН
1426	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОМе
1427	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Tedc	ОН
1428	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
1429	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1430	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1431	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1432	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОМе

1433	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1434	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1435	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Tedc	ОН
1436	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Tedc	OMe
1437	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1438	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1439	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
1440	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1441	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1442	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1443	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
1444	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
1445	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1446	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1447	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1448	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1449	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1450	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1451	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1452	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1453	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1454	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1455	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1456	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1457	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1458	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1459	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce) -Tdce	ОН
1460	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
1461	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН

67

1462	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1463	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
1464	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
1465	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1466	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1467	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1468	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1469	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1470	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1471	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0- (6-Tedce) -Tedc	ОН
1472	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	OMe
1473	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1474	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1475	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
1476	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1477	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce) <i>-</i> Dc	ОН
1478	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1479	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
1480	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
1481	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1482	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1483	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1484	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1485	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1486	3-(=0)-Myr	Ddc	· Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1487	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1488	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1489	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1490	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe

69

1491	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1492	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1493	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1494	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1495	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
1496	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
1497	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1498	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОМе
1499	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Tedc	ОН
1500	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
1501	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OH
1502	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1503	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1504	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1505	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Dc	ОН
1506	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1507	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
1508	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
1509	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1510	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1511	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
1512	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1513	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1514	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1515	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
1516	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
1517	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1518	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1519	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН

1520	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1521	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1522	3-(=0)-Myr	Ddc	А́с	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1523	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1524	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1525	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1526	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1527	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1528	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1529	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1530	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1531	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
1532	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
1533	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1534	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1535	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Tedc	ОН
1536	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Tedc	OMe
1537	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1538	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1539	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1540	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1541	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1542	3 - (=0) - Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1543	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
1544	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
1545	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1546	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1547	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
1548	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe

1549	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1550	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1551	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
1552	3-(=0)-Myr	Dc	Fo ·	3-0-(7-Tedce) -Tedc	OMe
1553	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1554	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1555	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1556	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1557	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1558	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1559	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1560	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1561	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1562	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1563	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1564	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1565	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1566	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce) -Dc	OMe
1567	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce) -Tdce	ОН
1568	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce) -Tdce	OMe
1569	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Dc	ОН
1570	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1571	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
1572	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
1573	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1574	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1575	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1576	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1577	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Dc	OH

1578	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1579	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OH
1580	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
1581	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1582	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1583	3-(=0)-Myr	Dc	Λc	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
1584	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1585	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1586	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1587	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
1588	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	OMe
1589	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1590	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1591	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1592	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1593	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1594	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1595	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1596	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1597	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1598	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1599	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce) -Tedc	ОН
1600	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1601	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1602	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1603	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce) -Tdce	ОН
1604	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
1605	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1606	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe

1607	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
1608	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
1609	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1610	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1611	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1612	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1613	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OH
1614	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1615	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	ОН
1616	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Tedc	OMe
1617	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1618	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1619	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce) -Tedc	ОН
1620	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1621	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1622	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1623	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
1624	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
1625	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1626	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1627	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1628	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1629	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1630	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1631	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1632	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1633	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1634	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1635	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН

1636	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1637	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1638	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1639	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
1640	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
1641	3-(=0)-Lau	· Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1642	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1643	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Tedc	ОН
1644	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Tedc	OMe
1645	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1646	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1647	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1648	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1649	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1650	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Dc	OMe
1651	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
1652	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
1653	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	. ОН
1654	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1655	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
1656	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1657	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1658	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1659	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
1660	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
1661	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1662	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1663	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1664	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe

1665	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1666	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1667	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1668	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1669	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1670	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1671	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1672	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1673	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1674	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1675	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
1676	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
1677	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1678	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Dc	OMe
1679	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
1680	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
1681	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1682	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1683	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1684	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1685	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1686	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОМе
1687	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
1688	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
1689	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1690	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1691	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
1692	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1693	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН

1694	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1695	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	ОН
1696	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Tedc	OMe
1697	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1698	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1699	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1700	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1701	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1702	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1703	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1704	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1705	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1706	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1707	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1708	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe
1709	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1710	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1711	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
1712	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	OMe
1713	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1714	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1715	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
1716	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
1717	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1718	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1719	3-(=0)Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1720	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1721	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1722	3-(=0)-Lau	Ddc .	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe

1723	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Tedc	ОН
1724	3- (=0) -Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
1725	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1726	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1727	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0- (6-Pdce) -Tedc	ОН
1728	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1729	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Dc	ОН
1730	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1731	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
1732	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	OMe
1733	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1734	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1735	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1736	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1737	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1738	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1739	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1740	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	0Me
1741	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1742	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1743	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1744	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Ddce) -Tedc	OMe
1745	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1746	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce)-Dc	0Me
1747	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce) -Tdce	ОН
1748	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tdce) -Tdce	OMe
1749	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1750	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1751	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce) -Tedc	ОН

78

1752	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(5-Tedce)-Tedc	OMe
1753	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OH
1754	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1755	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1756	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1757	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1758	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1759	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
1760	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Tedce) -Tedc	OMe
1761	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1762	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1763	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
1764	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1765	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce) -Dc	ОН
1766	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1767	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
1768	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Tedce) -Tedc	OMe
1769	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1770	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1771	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1772	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1773	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН
1774	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1775	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	ОН
1776	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1777	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	ОН
1778	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Dc	OMe
1779	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	ОН
1780	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Ddce)-Tedc	OMe

1781	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	ОН
1782	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Dc	OMe
1783	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce)-Tdce	ОН
1784	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tdce) -Tdce	OMe
1785	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	ОН
1786	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Dc	OMe
1787	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce)-Tedc	ОН
1788	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(5-Tedce) -Tedc	OMe
1789	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	ОН
1790	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Dc	OMe
1791	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	ОН
1792	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tdce)-Tedc	OMe
1793	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	ОН
1794	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Dc	OMe
1795	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce) -Tedc	ОН
1796	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Tedce)-Tedc	OMe
1797	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	ОН
1798	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Dc	OMe
1799	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	ОН
1800	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(6-Pdce)-Tedc	OMe
1801	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	ОН
1802	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce)-Dc	OMe
1803	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОН
1804	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Tedce) -Tedc	ОМе
1805	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	ОН
1806	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Dc	OMe
1807	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	ОН
1808	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Pdce)-Tedc	OMe
1809	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	ОН

1810	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Dc	OMe
1811	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	0 H
1812	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-0-(7-Hdce)-Tedc	OMe
1813	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
1814	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
1815	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
1816	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
1817	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-OTedc-Tedc	OMe
1818	$[2, 2-(F)_2-Myr]$	Tedc	Fo	3-0Tedc-Tedc	ОН
1819	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Fo	3-0Dc-Dc	OMe
1820	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc [·]	Fo	3-ODc-Dc	ОН
1821	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
1822	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-ODdc-Dc	OH
1823	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
1824	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Fo	3-OTedc-Dc	ОН
1825	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
1826	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Ac	3-ODc-Tedc	ОН
1827	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОМе
1828	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
1829	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-OTedc-Tedc	OMe
1830	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-OTedc-Tedc	ОН
1831	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
1832	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac .	3-ODc-Dc	ОН
1833	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
1834	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Tedc	Ac	3-ODdc-Dc	ОН
1835	$2,2-(F)_2-Myr$	Tedc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
1836	$2, 2-(F)_2-Myr$	Tedc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН
1837	$2,2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
1838	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН

1839	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
1840	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
1841	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-OTedc-Tedc	OMe
1842	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-0Tedc-Tedc	ОН
1843	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-ODc-Dc	OMe
1844	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-ODc-Dc	OH
1845	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
1846	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
1847	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	· Fo	3-OTedc-Dc	OMe
1848	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Fo	3-OTedc-Dc	ОН
1849	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
1850	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-ODc-Tedc	ОН
1851	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
1852	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
1853	$_{2}$, 2-(F) $_{2}$ -Myr	Ddc	Ac	3-OTedc-Tedc	OMe
1854	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-0Tedc-Tedc	ОН
1855	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
1856	$2, 2-(F)_2-Myr$	Ddc	Ac	3-ODc-Dc	ОН
1857	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
1858	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-ODdc-Dc	ОН
1859	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
1860	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Ddc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН
1861	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Dc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
1862	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Dc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
1863	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
1864	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Dc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
1865	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Dc	Fo	3-0Tedc-Tedc	OMe
1866	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Dc	Fo	3-0Tedc-Tedc	ОН
1867	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Dc	Fo	3-ODc-Dc	OMe

1868	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Dc	Fo	3-ODc-Dc	ОН
1869	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
1870	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
1871	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
1872	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Fo	3-OTedc-Dc	ОН
1873	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
1874	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-ODc-Tedc	ОН
1875	$2,2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
1876	2 , $2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
1877	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-OTedc-Tedc	OMe
1878	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-OTedc-Tedc	ОН
1879	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
1880	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-ODc-Dc	ОН
1881	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
1882	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-ODdc-Dc	ОН
1883	$2, 2-(F)_2$ -Myr	Dc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
1884	$2, 2-(F)_2-Myr$	Dc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН
1885	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
1886	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
1887	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
1888	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
1889	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0Tedc-Tedc	OMe
1890	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-0Tedc-Tedc	ОН
1891	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-ODc-Dc	OMe
1892	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-ODc-Dc	ОН
1893	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
1894	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
1895	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
1896	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Fo	3-OTedc-Dc	ОН

1897	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
1898	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-ODc-Tedc	OH
1899	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
1900	2 , 2 – $(F)_2$ –Lau	Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
1901	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-0Tedc-Tedc	OMe
1902	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-OTedc-Tedc	ОН
1903	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
1904	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-ODc-Dc	ОН
1905	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
1906	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-ODdc-Dc	ОН
1907	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
1908	2, 2-(F) ₂ -Lau	Tedc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН
1909	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
1910	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
1911	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
1912	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
1913	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0Tedc-Tedc	OMe
1914	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-0Tedc-Tedc	ОН
1915	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-ODc-Dc	0Me
1916	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-ODc-Dc	ОН
1917	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Ddc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
1918	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
1919	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
1920	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Fo	3-OTedc-Dc	OH
1921	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
1922	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-ODc-Tedc	ОН
1923	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
1924	2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
1925	2 , 2 – $(F)_2$ –Lau	Ddc	Ac	3-OTedc-Tedc	ОМе

2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-0Tedc-Tedc	OH
2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-ODc-Dc	ОН
$2, 2-(F)_2$ -Lau	Ddc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-ODdc-Dc	ОН
2 , $2-(F)_2$ –Lau	Ddc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
2, 2-(F) ₂ -Lau	Ddc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН
2 , $2-(F)_2$ –Lau	Dc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-ODc-Tedc	OH
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-ODdc-Tedc	OH
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-OTedc-Tedc	OMe
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-0Tedc-Tedc	ОН
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-ODc-Dc	OMe
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-ODc-Dc	OH
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-ODdc-Dc	OH
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Fo	3-OTedc-Dc	OH
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-ODc-Tedc	ОН
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-0Tedc-Tedc	OMe
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-OTedc-Tedc	ОН
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-ODc-Dc	ОН
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-ODdc-Dc	OH
	2, $2-(F)_2$ -Lau	2, $2-(F)_2$ -Lau Ddc 2, $2-(F)_2$ -Lau Dc	$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	2, 2-(F) ₂ -Lau

1955	$2, 2-(F)_2$ -Lau	Dc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
1956	2, 2-(F) ₂ -Lau	Dc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН
1957	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
1958	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
1959	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
1960	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
1961	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-OTedc-Tedc	OMe
1962	3-(=0) -Myr	Tedc	Fo	3-0Tedc-Tedc	ОН
1963	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-ODc-Dc	OMe
1964	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-ODc-Dc	ОН
1965	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
1966	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
1967	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
1968	3-(=0)-Myr	Tedc	Fo	3-OTedc-Dc	ОН
1969	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
1970	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-ODc-Tedc	ОН
1971	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
1972	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
1973	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-OTedc-Tedc	OMe
1974	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-OTedc-Tedc	ОН
1975	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
1976	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-ODc-Dc	ОН
1977	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-ODdc-Dc	ОМе
1978	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-ODdc-Dc	ОН
1979	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
1980	3-(=0)-Myr	Tedc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН
1981	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
1982	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
1983	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe

1984	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-ODdc-Tedc	OH
1985	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-OTedc-Tedc	OMe
1986	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-0Tedc-Tedc	ОН
1987	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-ODc-Dc	OMe
1988	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-ODc-Dc	OH
1989	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
1990	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
1991	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
1992	3-(=0)-Myr	Ddc	Fo	3-OTedc-Dc	OH
1993	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
1994	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-ODc-Tedc	OH
1995	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
1996	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-ODdc-Tedc	OH
1997	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0Tedc-Tedc	OMe
1998	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-0Tedc-Tedc	OH
1999	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-ODc-Dc	ОМе
2000	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-ODc-Dc	OH
2001	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
2002	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-ODdc-Dc	OH
2003	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
2004	3-(=0)-Myr	Ddc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН
2005	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
2006	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
2007	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
2008	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
2009	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-OTedc-Tedc	OMe
2010	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-OTedc-Tedc	ОН
2011	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-ODc-Dc	OMe
2012	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-ODc-Dc	ОН

2013	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
2014	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
2015	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
2016	3-(=0)-Myr	Dc	Fo	3-OTedc-Dc	ОН
2017	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0Dc-Tedc	OMe
2018	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0Dc-Tedc	ОН
2019	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
2020	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
2021	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0Tedc-Tedc	OMe
2022	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-0Tedc-Tedc	ОН
2023	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
2024	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-ODc-Dc	ОН
2025	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
2026	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-ODdc-Dc	ОН
2027	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
2028	3-(=0)-Myr	Dc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН
2029	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
2030	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
2031	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
2032	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
2033	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0Tedc-Tedc	OMe
2034	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0Tedc-Tedc	ОН
2035	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-ODc-Dc	OMe
2036	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-0Dc-Dc	ОН
2037	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
2038	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
2039	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
2040	3-(=0)-Lau	Tedc	Fo	3-OTedc-Dc	ОН
2041	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe

87

88

2042	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-ODc-Tedc	ОН
2043	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
2044	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
2045	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0Tedc-Tedc	OMe
2046	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-0Tedc-Tedc	ОН
2047	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
2048	3-(=0)-Lau	Tedc	- Ac	3-ODc-Dc	ОН
2049	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
2050	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-ODdc-Dc	ОН
2051	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
2052	3-(=0)-Lau	Tedc	Ac	3-OTedc-Dc	ОН
2053	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
2054	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
2055	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
2056	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
2057	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-0Tedc-Tedc	OMe
2058	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-OTedc-Tedc	ОН
2059	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-ODc-Dc	OMe
2060	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-ODc-Dc	ОН
2061	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
2062	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
2063	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
2064	3-(=0)-Lau	Ddc	Fo	3-OTedc-Dc	ОН
2065	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
2066	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-ODc-Tedc	ОН
2067	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
2068	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
2069	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0Tedc-Tedc	OMe
2070	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-0Tedc-Tedc	ОН

89

2071	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
2072	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-ODc-Dc	ОН
2073	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
2074	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-ODdc-Dc	ОН
2075	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe
2076	3-(=0)-Lau	Ddc	Ac	3-OTedc-Dc	OH
2077	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-ODc-Tedc	OMe
2078	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-ODc-Tedc	ОН
2079	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-ODdc-Tedc	OMe
2080	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-ODdc-Tedc	ОН
2081	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-OTedc-Tedc	OMe
2082	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-OTedc-Tedc	ОН
2083	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-ODc-Dc	OMe
2084	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-ODc-Dc	OH
2085	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-ODdc-Dc	OMe
2086	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-ODdc-Dc	ОН
2087	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-OTedc-Dc	OMe
2088	3-(=0)-Lau	Dc	Fo	3-OTedc-Dc	ОН
2089	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-ODc-Tedc	OMe
2090	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-ODc-Tedc	OH
2091	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-ODdc-Tedc	OMe
2092	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-ODdc-Tedc	ОН
2093	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-OTedc-Tedc	OMe
2094	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-OTedc-Tedc	OH
2095	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-ODc-Dc	OMe
2096	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-ODc-Dc	ОН
2097	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-ODdc-Dc	OMe
2098	3-(=0)-Lau.	Dc	Ac	3-ODdc-Dc	ОН
2099	3-(=0)-Lau	Dc	Ac	3-OTedc-Dc	OMe

PCT/JP01/03005

90

Аc

2100 3-(=0)-Lau Dc

WO 01/77133

3-OTedc-Dc

OH

上記表中、好適なものとしては、7、8、12、13、45、46、69、70、74、75、107、108、113、114、119、120、249-316、517-732、949-1164及び1381-1596であり、

更に好適には、613、614、615、616、649、650、651、652、1045、1046、1047、1048、1081、1082、1083、1084、1117、1118、1119、1120、1153、1154、1155、1156、1549、1550、1551、1552、1585、1586、1587、1588、1959、1960、1983、1984、1995及び1996であり、特に好適には、

615: カルボキシメチル 2- デオキシ-6- O- [2- デオキシ-2- ホルムアミド-4- O- ホスホノ-3- O- [(R)-3- [7- (Z)- テトラデセニルオキシ]テトラデシル] $-\beta-$ D- グルコピラノシル]-3- O- ドデシル-2- テトラデカナミド $-\alpha-$ D- グルコピラノシド、

 $6 \ 1 \ 6 :$ カルボキシメチル 2 - デオキシ $- \ 6 -$ O - [2 - デオキシ $- \ 2 -$ ホルムアミド $- \ 6 -$ O - メチル $- \ 4 -$ O - ホスホノ $- \ 3 -$ O - [(R) - 3 - [7 - (Z) - テトラデセニルオキシ]テトラデシル] $- \ \beta -$ D - グルコピラノシル] $- \ 3 -$ O - ドデシル $- \ 2 -$ テトラデカナミド $- \ \alpha -$ D - グルコピラノシド、

651: カルボキシメチル $6-O-[2-Tセタミド-2-デオキシ-4-O-ホスホノ-3-O-[\cdot(R)-3-[7-(Z)-テトラデセニルオキシ]テトラデシル] - <math>\beta-D-$ グルコピラノシル] -2-デオキシ-3-O-ドデシル-2-テトラデカナミド $-\alpha-D-$ グルコピラノシド、

652: カルボキシメチル $6-O-[2-アセタミド-2-デオキシ-6-O-メチル-4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[7-(Z)-テトラデセニルオキシ] テトラデシル] <math>-\beta-D-$ グルコピラノシル] -2- デオキシ-3-O-ドデシル-2 -テトラデカナミド- $\alpha-D-$ グルコピラノシド、

1047: カルボキシメチル 2-デオキシ-6-O-[2-デオキシ-2-ホルムア ミド-4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[7-(Z)-テトラデセニルオキ

91

WO 01/77133 PCT/JP01/03005

[-1] [-1]

1048: カルボキシメチル 2-デオキシ-6-O-[2-デオキシ-2-ホルムア 2 ド-6-O-メチル-4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[7-(Z)-テトラデセニルオキシ]テトラデシル] $-\beta-$ D-グルコピラノシル]-2-(2、2-ジフルオロテトラデカナミド)-3-O-ドデシル $-\alpha-$ D-グルコピラノシド、

1083:カルボキシメチル 6 $-O-[2-Pセタミド-2-デオキシ-4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[7-(Z)-テトラデセニルオキシ]テトラデシル] <math>-\beta-D-$ グルコピラノシル]-2-デオキシ-2-(2、2-ジフルオロテトラデカナミド)-3-O-ドデシル $-\alpha-D-$ グルコピラノシド、

1084: カルボキシメチル $6-O-[2-Pセタミド-2-デオキシ-6-O-メチル-4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[7-(Z)-テトラデセニルオキシ]テトラデシル] <math>-\beta-D-$ グルコピラノシル] -2-デオキシー2-(2、2-ジフルオロテトラデカナミド) -3-O-ドデシル- $\alpha-D-$ グルコピラノシド、

1119:カルボキシメチル 2ーデオキシー6ーOー[2ーデオキシー2ーホルムアミドー4ーOーホスホノー3ーOー[(R) -3 - [7 - (Z) - テトラデセニルオキシ]テトラデシル] $-\beta$ - D - グルコピラノシル] -3 - O - デシルー2 - (2、2 - ジフルオロテトラデカナミド) $-\alpha$ - D - グルコピラノシド、

1120: カルボキシメチル 2ーデオキシー6ーOー[2ーデオキシー2ーホルムア ミドー6ーOーメチルー4ーOーホスホノー3ーOー[(R) -3 - [7 - (Z) - テトラデセニルオキシ]テトラデシル] $-\beta$ - Dーグルコピラノシル] -3 - Oーデシル -2 - (2、2ージフルオロテトラデカナミド) $-\alpha$ - Dーグルコピラノシド、

1155: カルボキシメチル 6 $-O-[2-rセタミド-2-デオキシ-4-O-ホスホノ-3-O-[(R) -3-[7-(Z)-テトラデセニルオキシ]テトラデシル] <math>-\beta-D-$ グルコピラノシル]-3-O-デシルー2-デオキシー2-(2、2-ジフルオロテトラデカナミド) $-\alpha-D-$ グルコピラノシド、

1156:カルボキシメチル 6 $-O-[2-rセタミド-2-デオキシ-6-O-メチル-4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[7-(Z)-テトラデセニルオキシ]テトラデシル] <math>-\beta-D-$ グルコピラノシル] -3-O-デシルー2-デオキシー

2-(2,2-i)フルオロテトラデカナミド) $-\alpha-D-i$ グルコピラノシド、

1551:カルボキシメチル 6 $-O-[2-デオキシ-2-ホルムアミド-4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]テトラデシル] <math>-\beta-D-グルコピラノシル]-2-デオキシ-3-O-ドデシル-2-(3-オキソテトラデカナミド) <math>-\alpha-D-グルコピラノシド$ 、

1552:カルボキシメチル 6 $-O-[2-アセタミド-2-デオキシ-4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]テトラデシル] <math>-\beta-D-$ グルコピラノシル]-2-デオキシ-3-O-ドデシル-2-(3-オキソテトラデカナミド) $-\alpha-D-$ グルコピラノシド、

1587:カルボキシメチル $6-O-[2-デオキシ-2-ホルムアミド-6-O-メチル-4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]テトラデシル]-<math>\beta$ -D-グルコピラノシル]-2-デオキシ-3-O-ドデシル-2-(3-オキソテトラデカナミド)- α -D-グルコピラノシド、及び、

1588:カルボキシメチル 6-O-[2-rt9]ドー2-rt7オキシー6-O-メチルー4-O-ホスホノー3-O-[(R)-3-[(Z)-7-rt]テトラデセニルオキシ]テトラデシル] $-\beta-D-$ グルコピラノシル]-2-デオキシー3-O-ドデシル-2-(3-オキソテトラデカナミド) $-\alpha-D-$ グルコピラノシドである。

本発明の一般式(I)を有する化合物は、以下の方法により、公知化合物(II)(カルボハイドレート・リサーチ、第222巻、57頁(1991年))を出発原料として用いて、製造することができる。

A工程

R=CHPh2 or CH2CH=CH2

b法…6 位アルコキシ体

c法…6位H体・ハロゲン体

は法・・・プルキニル
$$R^6$$
 R^7 R^6 R^7 R^7 R^{10} $R^{$

上記工程中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵は前述したものと同意義を示す。

 R^6 及び R^7 は、同一又は異なって水素原子、 C_1-C_6 アルキル基又は C_6-C_{10} アリール基を示す。

 R^{8} は、下記(置換基群B)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい、 $C_{1}-C_{20}$ アルキル基、 $C_{2}-C_{20}$ アルケニル基又は $C_{2}-C_{20}$ アルキニル基であり、(置換基群B)は、ハロゲン原子、保護された水酸基(該保護基としては、好適には、トリクロロエトキシカルボニル基又はベンジル基である。)、オキソ基、オキソ基を有していてもよい $C_{1}-C_{20}$ アルコキシ基、オキソ基を有していてもよい $C_{2}-C_{20}$ アルケニルオキシ基、オキソ基を有していてもよい $C_{2}-C_{20}$ アルケニルオキシ基、オキソ基を有していてもよい $C_{1}-C_{20}$ アルカノイルオキシ基、オキソ基を有していてもよい $C_{1}-C_{20}$ アルカノイルオキシ基、オキソ基を有していてもよい $C_{1}-C_{20}$ アルカノイルオキシ基、オキソ基を有していてもよい

てもよい $C_3 - C_{20}$ アルケノイルオキシ基及びオキソ基を有していてもよい $C_3 - C_2$ 。アルキノイルオキシ基からなる群である。

R°は、上記(置換基群B)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい、 C_1-C_{20} アルカノイル基、 C_3-C_{20} アルケノイル基又は C_3-C_{20} アルキノイル基である。

 R^{10} は、下記(置換基群C)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい、 C_1-C_{20} アルキル基、 C_2-C_{20} アルケニル基又は C_2-C_{20} アルキニル基であり、(置換基群C)は、ハロゲン原子、保護された水酸基(該保護基としては、好適には、トリクロロエトキシカルボニル基又はベンジル基である)、オキソ基、オキソ基を有していてもよい C_1-C_{20} アルコキシ基、オキソ基を有していてもよい C_2-C_{20} アルケニルオキシ基、オキソ基を有していてもよい C_2-C_{20} アルケニルオキシ基、オキソ基を有していてもよい C_1-C_{20} アルカノイルオキシ基、オキソ基を有していてもよい C_3-C_{20} アルケノイルオキシ基及びオキソ基を有していてもよい C_3-C_{20} アルキノイルオキシ基からなる群である。

R¹¹は、水酸基の保護基であり、好適には、ベンジルオキシカルボニル基又はアリルオキシカルボニル基である。

 R^{12} は、1-プロペニル基である。

 R^{13} は、アリル基、置換基を有してもよい $C_6 - C_{10}$ アリール基又は置換基を有してもよい $C_7 - C_{11}$ アラルキル基を示し、好適には、アリル基、フェニル基又はベンジル基である。

 R^{14} 、 R^{15} 及び R^{16} は、同一又は異なって、 C_1-C_4 アルキル基又は C_6-C_{10} アリール基を示す。

 R^{17} は、オキソ基を有していてもよい $C_1 - C_6$ アルキル基を示す。

R¹⁸は、水素原子又はハロゲン原子を示す。

 R^{19} は、水素原子、ハロゲン原子、保護された水酸基(該保護基としては、好適には、ベンジルオキシカルボニル基又はアリルオキシカルボニル基である。)、オキソ基を有していてもよい C_1-C_6 アルコキシ基、オキソ基を有していてもよい C_2-C_6 アルケニルオキシ基又はオキソ基を有していてもよい C_2-C_6 アルキニルオキシ基を示す。

本願発明の化合物(I)を製造する工程は3工程からなる。

- (1) A工程は、中間体(VI)を製造する工程である。
- (2) B工程は、中間体(XIII)、(XIX)及び(XXII)を製造する工程である。R⁵の 種類に応じて、a法、b法及びc法の3種類の方法を記載する。
- (3) C工程は、中間体 (VI) と中間体 (XIII)、(XIX) 及び (XXII) を縮合し、目的 化合物 (I) を製造する工程である。

以下、各工程につき、説明する。

(1) A工程

(第A1工程)

本工程は、化合物(II)の3位水酸基がアルキル化(アルケニル基、アルキニル基を導入する場合も含む。以下、製造工程の説明において、同様の定義とする。)された化合物(III)を製造する工程であり、不活性溶剤中、強塩基によって化合物(II)のアルコキシドを発生させ、アルキル化剤を反応させることによって達成される。

使用される溶剤としては、例えば、ジオキサン、テトラヒドロフランなどのエーテル類;ホルムアミド、ジメチルホルムアミドなどのアミド類;ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類があげられるが、好適には、ジメチルホルムアミドである。

使用される塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの水酸化アルカリ金属; n-ブチルリチウム、t-ブチルリチウムなどのアルキルリチウム類; 水素化カリウム、水素化ナトリウムなどの水素化アルカリ金属等があげられるが、好適には、水素化ナトリウムである。

使用されるアルキル化剤としては、例えば、ハロゲン化炭化水素類、スルホン酸エステル類があげられるが、好適には、メタンスルホン酸エステルである。本工程では、式: $R^sOSO_2CH_3$ (式中、 R^s は前記と同意義を示す。)で表されるアルキル化剤が使用される。

反応温度は、-78 乃至 80℃で行われるが、好適には、0 乃至 60℃である。

反応時間は、反応温度、原料、試薬または使用される溶剤等によって異なるが、通常、2万至48時間であり、好適には、2万至24時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物(III)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を中和した後、濃縮し、酢酸エチルのような水と混和しない 有機溶剤を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム 等で乾燥後、溶剤を留去することで得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等により、精製することもできる。

(第A2工程)

本工程は、化合物(III)の2位がアシル化された化合物(IV)を製造する工程であり、まず、脱保護反応を行い、続いて、アシル化をすることによって達成される。

①脱保護反応

本工程は、不活性溶剤中、アルカリ条件下、化合物(III)の2位を脱保護する工程である。

使用される溶剤としては、例えば、メタノール、エタノールのようなアルコール類; ジエチルエーテル、テトラヒドロフランのようなエーテル類;アセトニトリルのよう なニトリル類;アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類があげられるが、好 適にはアルコール類(エタノール)である。

使用されるアルカリとしては、例えば、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素類;水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような水酸化アルカリ金属;ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドのようなアルカリ金属アルコキシドがあげられるが、好適には、水酸化アルカリ金属である。

反応温度は、0乃至100℃で行われるが、好適には、25乃至80℃である。

反応時間は、通常30分乃至24時間であり、好適には、1乃至5時間である。

②アシル化

本工程は、不活性溶剤中、縮合剤及び塩基の存在又は非存在下、アシル化剤で処理 する工程である。

使用される溶剤としては、例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類;メチレンクロリド、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類;N,Nージメチルホルムアミドのようなアミド類をあげることができるが、好適には、メチレンクロリドである。

使用される縮合剤としては、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド、1,3-ジイソプロピルカルボジイミドなどのカルボジイミド類をあげることができるが、好適には、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミドである。

使用される塩基としては、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミンのような有機塩基類をあげることができるが、好適には、4-ジメチルアミノピリジンである。

使用されるアシル化剤としては、式:R°OHで表されるカルボン酸、または、式:R°CI(式中、R°は前記と同意義を示す。)で表される酸クロライドがあげられる。 これらのアシル化剤が、水酸基又はオキソ基を有する場合、かかる基は保護されていてもよく、例えば、オキソ基は、アセタール基として保護される。

反応温度は、0乃至50℃であり、好適には、15乃至25℃(室温)である。

反応時間は、1乃至24時間であり、好適には1乃至5時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物(IV α)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物をろ過し、酢酸エチルのような水と混和しない有機溶剤を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留去することで得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等により、精製することもできる。

(第A3工程)

本工程は、化合物 (IV) の1位アリル基を段階的に酸化して、カルボキシメチル基へと変換したのち、エステル化して化合物 (V) を製造する工程であり、酸化剤およびエステル化剤を処理することによって達成される。

①アリル基からカルボキシメチル基への段階的な酸化

本工程は、不活性溶剤中、四酸化オスミウムとNーメチルモルホリン Nーオキシドにより、化合物(IV)のオレフィン部分をジオールにしたのち、四酢酸鉛で酸化開製してアルデヒドとし、さらに、アルデヒドを亜塩素酸ナトリウム、リン酸二水素ナトリウム二水和物によって酸化して、カルボン酸へ変換する工程である。

四酸化オスミウムによるオレフィンの酸化反応は、Nーメチルモルホリン Nーオキシドを共酸化剤として、触媒的に行うことができる。

使用される溶剤としては、例えば、水ーアセトン系、水ーtertーブチルアルコール系、水ーテトラヒドロフラン系などがあげられる。

反応時間は、1万至10時間である。

反応温度は、-20 乃至 80℃である。

四酢酸鉛によるジオールの酸化開裂に使用される溶剤は、主にベンゼン、トルエンなどの芳香族炭化水素類である。

反応時間は、1乃至8時間である。

反応温度は、-20 乃至 100℃である。

亜塩素酸ナトリウムによるアルデヒドの酸化反応に使用される溶剤としては、例えば、水ージオキサン系、水一酢酸系、水ーテトラヒドロフラン系、水ーtertーブチルアルコール系などがあげられる。

反応時間は、1乃至18時間である。

反応温度は、0乃至80℃である。

②エステル化

本工程は、不活性溶剤中、上記①で得られたカルボン酸にエステル化剤を反応させて達成される。

使用される溶剤としては、例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類;メチレンクロリド、クロロホルム、四塩化炭素などのハロゲン化炭化水素類;ジメチルホルムアミドなどのアミド類;酢酸エチルなどのエステル類があげられる。

使用されるエステル化剤としては、のちに再びもとのカルボン酸を回復することのできるようなエステル化剤であれば特に限定されないが、好適には、ジフェニルジアゾメタン、アリルブロマイドと炭酸ナトリウム等の塩基の組み合わせ、又は、アリルアルコールとDCCのような縮合剤の組み合わせである。

反応温度は、25 乃至 60℃である。

反応時間は、1万至10時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物(V)は常法に従って、反応混合物から採取される。 例えば、反応混合物を濃縮し、酢酸エチルのような水と混和しない有機溶剤を加え、 水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤 を留去することで得られる。 得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等により、精製することもできる。

(第A4工程)

本工程は、化合物(V)の4位及び6位の水酸基の保護基を酸処理により脱保護する ことによって達成される。

使用される酸としては、例えば、塩酸、硫酸のような無機酸;酢酸、しゅう酸のような有機酸があげられるが、好適には有機酸であり、更に好適には、水で希釈(70~90%)した酢酸である。

反応温度は、40 乃至80℃である。

反応時間は、30分乃至5時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物 (VI) は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を中和した後、濃縮し、酢酸エチルのような水と混和しない 有機溶剤を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム 等で乾燥後、溶剤を留去することで得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等により、精製することもできる。

尚、R⁹が、アセタールにより保護された置換基を有する場合、本工程により同時 に脱保護され、オキソ基を与える。

(2) B工程

(2-1) a法

本方法は、R⁵が水酸基である化合物(I)の製造に用いる中間体(XIII)の製法である。

(第Ba1工程)

本工程は、化合物(II)の3位水酸基がアルキル化された化合物(VII)を製造する工程であり、第A1工程と同様の条件で処理することによって達成される。

(第Ba2工程)

本工程は、化合物(VII)の2位を脱保護したのち、再び2位アミノ基を保護した化合物(VIII)を製造する工程である。

①脱保護反応

本工程は、第A2工程①と同様の条件で処理することによって達成される。

②保護化反応

本工程は、不活性溶剤中、塩基の存在下、保護化剤を反応させて達成される。

使用される溶剤としては、例えば、メチレンクロリド、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系炭化水素類;エーテル、ジオキサン、テトラヒドロフランのようなエーテル類;アセトニトリルのようなニトリル類があげられるが、好適にはハロゲン化炭化水素類であり、特に好適にはメチレンクロリドである。

使用される塩基としては、例えば、ピリジン、ジメチルアミノピリジンのようなピリジン類;トリエチルアミン、トリブチルアミンのようなトリアルキルアミン類;炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素塩類などがあげられるが、好適には、アルカリ金属炭酸水素塩類(炭酸水素ナトリウム)である。

使用される保護化剤としては、後述する第C1工程のグリコシル化を妨げないものであればよく、好適には、トリクロロエトキシカルボニルクロリドである。

反応温度は、-20 乃至 60℃であり、好適には、0 乃至 25℃である。

反応時間は、通常30分乃至24時間であり、好適には、1乃至5時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物(VIII)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を溶剤で希釈し、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留去することで得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等により、精製することもできる。

(第Ba3工程)

本工程は、化合物 (VIII) の4位及び6位水酸基の保護基が脱保護された化合物 (IX) を製造する工程であり、前記 (第A4工程) と同様の条件で処理することによって達成される。

(第Ba4工程)

本工程は、所望により化合物(IX)の1位アリル基を異性化させた後、6位水酸基 が選択的に保護された化合物(X)を製造する工程である。

R¹⁰に不飽和結合が存在する場合は、以下の工程中で保護基を導入する場合は、還元反応を用いないで除去することのできるアリル基又はアリルオキシカルボニル基を

105

使用するため、それらのアリル基と1位アリル基とを差別化するために以下の①に述べた異性化反応を行う必要があり、 R^{10} に不飽和結合が存在しない場合は、直ちに②の保護化反応を行ってよい。

①1位アリル基の異性化反応

本工程は、不活性溶剤中、化合物(XI)の1位アリル基を金属触媒によって異性化させる反応である。

使用される溶剤は、例えば、メチレンクロリド、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類;エーテル、ジオキサン、テトラヒドロフランのようなエーテル類;酢酸エチルのようなエステル類;アセトニトリルのようなニトリル類が挙げられるが、好適には、エーテル類であり、更に好適にはテトラヒドロフランである。

使用される金属触媒としては、パラジウム、ロジウム、イリジウムなどの錯体が用いられるが、好適には、(1, 5-シクロオクタジエン)ビス(メチルジフェニルホスフィン)イリジウム(I)へキサフルオロホスフェート($[Ir(COD)(PMePh_2)_2]PF_6$)である。

反応温度は、0乃至50℃であり、好適には、5乃至30℃である。

反応時間は、10分乃至24時間であり、好適には、30分乃至8時間である。

②6位水酸基の保護化反応

本反応は、不活性溶剤中、塩基存在下、保護化剤を処理することによって達成される。

使用される溶剤としては、例えば、メチレンクロリド、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類;エーテル、ジオキサン、テトラヒドロフランのようなエーテル類;酢酸エチルのようなエステル類があげられるが、好適には、メチレンクロリドである。

使用される塩基としては、例えば、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリンのような有機塩基類があげられるが、好適には、ピリジンである。

使用される保護化剤としては、脱保護処理を行うことによって6位水酸基が収率良く回復できるものであればよく、例えば、tert-ブトキシカルボニルクロリドのようなアルキルオキシカルボニルハライド、ベンジルオキシカルボニルクロリドのようなア

ラルキルオキシカルボニルハライド、アリルオキシカルボニルクロリドのようなアルケニルオキシカルボニルハライドがあげられるが、 R^{10} に不飽和結合が存在しない場合は、好適には、ベンジルオキシカルボニルクロリドであり、 R^{10} に不飽和結合が存在する場合は、好適には、アリルオキシカルボニルクロリドである。

反応温度は、-50 乃至 50℃であり、好適には、-10 乃至 30℃である。

反応時間は、10分乃至24時間であり、好適には、30分乃至5時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物(X)は常法に従って、反応混合物から採取される。 例えば、反応混合物を中和した後、濃縮し、酢酸エチルのような水と混和しない有機 溶剤を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム等で 乾燥後、溶剤を留去することで得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等により、精製することもできる。

(第Ba5工程)

本工程は、化合物(X)の4位水酸基がリン酸化された化合物(XI)を製造する工程であり、不活性溶剤中、塩基存在下、リン酸化剤で処理することにより達成される。

使用される溶剤は、例えば、メチレンクロリド、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン系炭化水素類;エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類;酢酸エチルのようなエステル類があげられるが、好適にはハロゲン化炭化水素類(メチレンクロリド)である。

使用される塩基は、例えば、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリンのような有機塩基類があげられるが、好適にはジメチルアミノピリジンである。

リン酸化剤は、式: $(R^{13}0)_2P(=0)X$ (式中、 R^{13} は前記と同意義を示し、Xは塩素、臭素、よう素のようなハロゲン原子を示し、好適には塩素原子である。)で表されるリン酸ハライドが使用される。リン酸ハライドとしては、後述する第C3工程においてリン酸エステル化合物(XXIX)を脱保護してリン酸化合物(I)に変換する際、保護基 R^{13} が収率良く容易に除去できるようなものであればよく、 R^{10} に不飽和結合が存在しない場合は、好適には、フェニルホスホリルクロリド又はベンジルホスホリルクロリドであり、 R^{10} に不飽和結合が存在する場合は、好適には、ビス(アリルオ

キシ)(ジイソプロピルアミノ)ホスフィンとテトラゾールのような塩基でジアリルホスファイトとし、それを更にメタクロル過安息香酸又は過酸化水素水にて酸化することにより、ジアリルリン酸エステルとする。

反応温度は、-20 乃至 50℃であり、好適には-10 乃至 30℃である。

反応時間は、10分乃至24時間であり、好適には、30分乃至5時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物(XI)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を中和した後、濃縮し、酢酸エチルのような水と混和しない 有機溶剤を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム 等で乾燥後、溶剤を留去することで得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等により、精製することもできる。

(第Ba6工程)

本工程は、化合物(XI)の1位保護基が脱保護された化合物(XII)を製造する工程である。

R¹⁰に不飽和結合が存在しない場合は、前記(第Ba4工程)の①と同様にして化合物(XI)の1位アリル基を金属触媒によって異性化させ、その後加水分解を行う。

R¹⁰に不飽和結合が存在する場合は、既に1位アリル基が異性化されているので、加水分解反応のみ行う。

異性化したビニルエーテルの加水分解は、塩酸や硫酸のような無機酸;ギ酸、p-トルエンスルホン酸などの有機酸を作用させるか、あるいは、水中でヨウ素を作用させて行われるが、好適には、ピリジン-水の混合溶媒中でヨウ素を作用させて行われる。

反応温度は、0乃至 100℃であり、好適には、25 乃至 45℃である。

反応時間は、10分乃至24時間であり、好適には、30分乃至5時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物(XII)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物に酢酸エチルのような水と混和しない有機溶剤を加え、チオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留去することで得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラ

WO 01/77133

108

PCT/JP01/03005

フィー等により、精製することもできる。

(第Ba7工程)

本工程は、中間体であるトリクロロアセトイミデート体(XIII)を製造する工程であり、化合物(XII)の1位水酸基に、不活性溶剤中、塩基存在下、トリクロロアセトニトリルを作用させることにより達成される。

使用される溶剤は、例えば、メチレンクロリド、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類;エーテル、ジオキサン、テトラヒドロフランのようなエーテル類;酢酸エチルのようなエステル類;アセトニトリルのようなニトリル類が挙げられるが、好適には、ハロゲン化炭化水素類(メチレンクロリド)である。

使用される塩基としては、例えば、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン (DBU) などの有機塩基;又はナトリウムヒドリド、炭酸カリウム、炭酸セシウムなど の無機塩基があげられ、好適には、炭酸セシウムである。

反応温度は、-25 乃至 50℃であり、好適には、0 乃至 25℃である。

反応時間は、10 乃至 24 時間であり、好適には、30 分乃至 2 時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物(XIII)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を中和した後、濃縮し、酢酸エチルのような水と混和しない有機溶剤を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留去することで得られる。

(2-2) b法

本方法は、R⁵がアルコキシ基である化合物(I)の製造に用いる中間体(XIX)の製法である。

(第Bb1工程)

本工程は、所望により前記(第Ba1乃至Ba3工程)で得られた化合物(IX)の 1位アリル基を異性化させた後、6位水酸基が選択的に保護された化合物(XIV)を製 造する工程である。

 R^{10} に不飽和結合が存在する場合は、前記(第Ba4工程)の①と同様にして化合物(IX)の1位アリル基を異性化させる必要があり、 R^{10} に不飽和結合が存在しない場合は、直ちに保護化反応を行う。

保護化反応は、不活性溶剤中、塩基存在下、シリル化剤を処理させることによって

達成される。

使用される溶剤としては、例えば、メチレンクロリド、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類;エーテル、ジオキサン、テトラヒドロフランのようなエーテル類;アセトニトリルのようなニトリル類があげられるが、好適には、メチレンクロリドである。

使用される塩基としては、例えば、ピリジン、ジメチルアミノピリジンのようなピリジン類;トリエチルアミン、トリブチルアミンのようなトリアルキルアミン類;アニリン、N,Nージメチルアニリンのようなアニリン類;2,6-ルチジンのようなルチジン類があげられるが、好適には、ジメチルアミノピリジンである。

使用されるシリル化剤は、式:R¹⁴R¹⁵R¹⁶SiY(式中、R¹⁴R¹⁵R¹⁶は前記と同意義を示し、Yはハロゲン原子又はトリフルオロメタンスルホニル基を示す。)で表されるトリアルキルシリルハライド又はトリアルキルシリルトリフルオロメタンスルホナートを用いるが、好適には、tertーブチルジメチルシリルクロリドである。

反応温度は、0乃至50℃であり、好適には、15乃至25℃である。

反応時間は、1時間乃至24時間であり、好適には、1時間乃至8時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物(XIV)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を中和した後、濃縮し、酢酸エチルのような水と混和しない有機溶剤を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留去することで得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等により、精製することもできる。

(第Bb2工程)

本工程は、化合物(XIV)の4位水酸基がリン酸化された化合物(XV)を製造する工程であり、前記(第Ba5工程)と同様の条件で処理することによって達成される。

(第Bb3工程)

本工程は、化合物(XV)の6位保護基を除去して化合物(XVI)を製造する工程であり、不活性溶剤中、酸性条件下で加水分解することによって達成される。

加水分解に使用される酸としては、塩酸、硫酸のような無機酸、酢酸、しゅう酸のような有機酸があげられるが、好適には、3 N塩酸水溶液である。

110

使用される溶剤は、ジオキサン、テトラヒドロフランのような水溶性のもので、好 適には、テトラヒドロフランである。

反応温度は、20 乃至 80℃であり、好適には、20 乃至 50℃である。

- 反応時間は、30 分乃至 24 時間であり、好適には、1 乃至 8 時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物(XVI)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を中和した後、濃縮し、酢酸エチルのような水と混和しない 有機溶剤を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム 等で乾燥後、溶剤を留去することで得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等により、精製することもできる。

(第Bb4工程)

本工程は、化合物(XVI)の6位水酸基がアルキル化された化合物(XVII)を製造する工程であり、以下の①の方法で達成される。特に、 R^{17} がメチル基の場合には、②の方法を用いることができる。

① R^{17} が、 $C_1 - C_6$ アルキル基である場合

本工程は、不活性溶剤中、塩基又は酸化銀(II)(AgO)の存在下、化合物(XVIII)をアルキル化剤で処理することによって達成される。

使用される溶剤としては、反応を阻害せず、出発物質をある程度以上溶解するものであれば特に限定はなく、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロインのような脂肪族炭化水素類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;メチレンクロリド、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類;酢酸エチル、酢酸プロピル、炭酸ジエチルのようなエステル類;ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類;アセトニトリル、イソブチロニトリルのようなニトリル類;ホルムアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミドのようなアミド類をあげることができるが、好適には、エーテル類である。

使用される塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩類;炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素塩類;水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属水素化物類; Nーメチルモ

使用されるアルキル化剤としては、式: R¹¹Z(式中、R¹¹は前記と同意義を示し、 Zはヨウ素原子、臭素原子、塩素原子、パラトルエンスルホニルオキシ基又はメタン スルホニルオキシ基である。)をあげることができる。

反応温度は、0乃至 100℃で行われるが、好適には、0乃至 30℃である。 反応時間は、10分乃至 24 時間であり、好適には、1乃至 18 時間である。

②R¹⁷が、メチル基である場合

本工程は、不活性溶剤中、塩基存在下、化合物(XVI)をトリメチルオキソニウムテトラフルオロボレートで処理することによって達成される。

使用される溶剤としては、例えば、エーテル、ジオキサン、テトラヒドロフランのようなエーテル類;メチレンクロリド、クルルホルム、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素;ホルムアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミドのようなアミド類をあげることができるが、好適には、メチレンクロリドである。

使用される塩基としては、好適には、2,6-ジーtert-ブチル-4-メチルピリジン をあげることができる。

反応温度は、-50 乃至 100℃で行われるが、好適には、0 乃至 30℃である。

反応時間は、1乃至24時間であり、好適には、2乃至5時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物(XVII)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を中和した後、濃縮し、酢酸エチルのような水と混和しない有機溶媒を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留去することで得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等によって更に精製できる。

(第Bb5工程)

本工程は、化合物(XVII)の1位保護基が脱保護された化合物(XVIII)を製造する工程であり、前記(第Ba6工程)と同様の条件で処理することによって達成される。

(第Bb6工程)

本工程は中間体であるトリクロロアセトイミデート体(XIX)を製造する工程であり、 前記(第Ba7工程)と同様の条件で処理することによって達成される。

(2-3) c法

本方法は、R⁵が水素原子又はハロゲン原子である化合物(I)の製造に用いる中間体(XXII)の製法である。

(第Bc1工程)

本工程は、前記(第Bb1乃至Bb3工程)で得られた化合物(XVI)の6位水酸基がハロゲン原子又は水素原子に変換された化合物(XX)を製造する工程である。

(第Bc1-1工程)

本工程は、化合物(XX)の R^{18} が、ハロゲン原子である場合の製造方法であり、以下の①、②又は③の方法で行われる。

①R¹⁸が、フッ素原子である場合

本工程は、不活性溶剤中、化合物(XVI)をフッ素化剤で処理することによって達成される。

使用される溶剤としては、例えば、メチレンクロリド、フルオロトリクロロメタンのようなハロゲン化炭化水素類;エーテル、1,2-ジメトキシエタンのようなエーテル類をあげることができるが、好適には、メチレンクロリドである。

使用されるフッ素化剤としては、例えば、(2-クロロエチル)ジエチルアミン、 ジエチルアミノサルファートリフルオリド(DAST)をあげることができるが、好適には、 DASTである。

反応温度は、-78 乃至 25℃で行われるが、好適には、0 乃至 25℃である。 反応時間は、1 乃至 18 時間であるが、好適には、1 乃至 5 時間である。

② R 18 が、塩素原子又は臭素原子である場合

本工程は、不活性溶剤中、化合物(XVI)に三塩化リン、三臭化リン、三塩化ホスホリル、三臭化ホスホリル、塩化チオニル又は臭化チオニルを反応させることによって

113

達成される。

使用される溶剤としては、好適には、メチレンクロリド、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類である。

反応温度は、-50 乃至 50℃で行われるが、好適には、-10 乃至 30℃である。

反応時間は、1万至18時間であるが、好適には、1万至5時間である。

③R¹⁸が、ヨウ素原子である場合

本工程は、不活性溶剤中、化合物(XVI)にヨウ素及びトリフェニルホスフィンを反応させることによって達成される。

使用される溶剤としては、反応を阻害せず、出発物質をある程度以上溶解するものであれば特に限定はなく、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロインのような脂肪族炭化水素類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;メチレンクロリド、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類;酢酸エチル、酢酸プロピル、炭酸ジエチルのようなエステル類;ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類;メタノール、エタノールのようなアルコール類;ホルムアミド、N,Nージメチルホルムアミド、N,Nージメチルホルムアミド、N,Nージメチルアセトアミドのようなアミド類をあげることができるが、好適には、エーテル類である。

反応温度は、-50 乃至 100℃で行われるが、好適には、0 乃至 30℃である。

反応時間は、1乃至18時間であるが、好適には、1乃至5時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物(XX)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を中和した後、濃縮し、酢酸エチルのような水と混和しない有機溶媒を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留去することで得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等により、精製することもできる。

(第Bc1-2工程)

本工程は、化合物(XX)の R^{18} が、水素原子である場合に行われる工程であり、前記(第Bc1-1工程)の②で得られた R^{18} が臭素原子である化合物に、不活性溶剤中、テトラブチル錫ハイドライド又はリチウムアルミニウムハイドライドを反応させ

て行われる。

使用される溶剤としては、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロインのような脂肪 族炭化水素類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;ジエチル エーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエー テル類をあげることができるが、好適には、エーテル類である。

反応温度は、-50 乃至 50℃で行われるが、好適には、-10 乃至 30℃である。

反応時間は、10分乃至16時間であるが、好適には、1乃至8時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物(XX)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を中和した後、濃縮し、酢酸エチルのような水と混和しない 有機溶媒を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム 等で乾燥後、溶剤を留去することで得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等により、精製することもできる。

(第Bc2工程)

本工程は、化合物(XX)の1位保護基が脱保護された化合物(XXI)を製造する工程であり、前記(第Ba6工程)と同様の条件で処理することによって達成される。

(第Bc3工程)

本工程は中間体であるトリクロロアセトイミデート体(XXII)を製造する工程であり、前記(第Ba7工程)と同様の条件で処理することによって達成される。

(2-4) d法

本方法は、R¹⁰が二重結合、三重結合を含む中間体(XIII)、(XIX) 又は(XXII)を、別途、製造する工程である。

(第Bd1工程)

本工程は、化合物(XXIII)の1位のアリル基を異性化させる工程であり、前記(第 Ba4①工程)と同様の条件で処理することによって達成される。

(第Bd2工程)

本工程は、化合物(XXIV)の3位の水酸基をアルキル化する工程であり、前記(第A1工程)と同様の条件で処理することによって達成される。

(第 B d 3 工程)

115

本工程は、化合物(XXV)の2位のアジドを還元してアミンに変換した後、保護する工程である。

①アミン合成反応

本工程は、不活性溶剤中、還元剤を作用させることによって達成される。

使用される溶剤としては、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類であり、好適には、テトラヒドロフランである。

使用される還元剤としては、例えば、水素化リチウムアルミニウム、水素化ホウ素 ナトリウム等の金属水素化物類等であり、好適には、水素化リチウムアルミニウムで ある。

反応温度は、-50 乃至 100℃で行われるが、好適には、0 乃至 50℃である。

反応時間は、0.5 乃至 24 時間であり、好適には、1 乃至 5 時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物は常法に従って、反応混合物から採取される。例 えば、反応混合物を中和した後、濃縮し、酢酸エチルのような水と混和しない有機溶 媒を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム等で乾 燥後、溶剤を留去することで得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等によって更に精製できる。

②保護化反応

本工程は、前記(第Ba 2②工程)と同様の条件で処理することによって達成される。

(第Bd4工程)

本工程は、化合物(XXVI)の4位及び6位の水酸基の保護基を酸処理により脱保護する工程であり、前記(第A4工程)と同様の条件によって達成されるが、好適には、酸としてp-トルエンスルホン酸を用いて行われる。

(第Bd5工程)

本工程は、化合物(XXVII)の6位の水酸基を保護する工程であり、前記(第Ba4 ②工程)と同様の条件で処理することによって達成される。

本工程により得られた化合物(X)を用いて、第Ba5工程以降を行うことにより、中間体(XIII)を得ることができる。

WO 01/77133

PCT/JP01/03005

116

(第Bd6工程)

本工程は、化合物(XXVIII)の6位の水酸基を保護する工程であり、前記(第Bb1工程)と同様の条件で処理することによって達成される。

本工程により得られた化合物(XIV)を用いて、第Bb2工程以降を行うことにより、中間体(XIX)又は(XXII)を得ることができる。

(3) C工程

(第C1工程)

本工程は、中間体(XIII)、(XIX)、又は(XXII)と中間体(VI)との反応により、 リピッドA構造を有する化合物(XXVIII)を製造する工程であり、化合物(XIII)、(XIX) 又は(XXII)と化合物(VI)を不活性溶剤中、酸触媒存在下でグリコシル化させるこ とによって達成される。

使用される溶剤としては、例えば、メチレンクロリド、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類;ジエチルエーテルなどのエーテル類;アセトニトリルなどのニトリル類;トルエン、ベンゼンなどの芳香族炭化水素類;N,Nージメチルホルムアミドなどのアミド類があげられるが、好適には、ハロゲン化炭化水素類であり、特に好適には、メチレンクロリドである。

使用される触媒としては、四塩化スズ、トリフルオロボロン/エーテラート、塩化 アルミニウム、塩化第二鉄、トリメチルシリルトリフレート等のルイス酸があげられ るが、好適には、トリメチルシリルトリフレートである。

反応温度は、-100 乃至 25℃で行われるが、好適には、-78 乃至 0 ℃である。

反応時間は、通常10分乃至10時間であり、好適には、30分乃至5時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物(XXVIII)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を中和した後、濃縮し、酢酸エチルのような水と混和しない有機溶剤を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留去することで得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等により、精製することもできる。

(第C2工程)

本工程は、化合物(XXVIII)のトリクロロエトキシカルボニル基を除去し、アシル

基R³で変換した化合物(XXIX)を製造する工程であり、不活性溶剤中、化合物(XXVIII) に脱保護剤を作用させた後、アシル化剤を処理することによって達成される。

脱保護工程に使用される溶剤は、酢酸であり、トリクロロエトキシカルボニル基の 脱保護剤は亜鉛である。

反応温度は、0万至80℃で行われるが、好適には、10万至30℃である。

反応時間は、1乃至24時間であり、好適には、1乃至8時間である。

アシル化剤としては、式: R^3OH で表されるカルボン酸、又は、式: $(R^3)_2O$ で表される酸無水物が使用され、前記(第A2工程)の②と同様の条件でアシル化を行うことができる。式中、 R^3 は前記と同意義である。

(第C3工程)

本工程は、目的化合物(I)を製造する工程であり、化合物(XXIX)の1位保護基、及び、R⁹、R⁸、R¹⁰及びR¹⁹中の水酸基の保護基並びにリン酸基中の保護基R¹³を脱保護する工程であり、文献(T. W. Greene, Protective Groups in Organic Synthesis)に記載の方法に従って、又は、以下の方法を用いて達成される。また、化合物(XXVI)に数種類の保護基が存在する場合は、保護基に応じた方法を組み合わせて順次行うことができる。

①保護基がアラルキル基である場合

保護基がアラルキル基である場合は、不活性溶剤中、触媒存在下、水素雰囲気下の 接触還元によって脱保護することができる。

使用される溶剤としては、例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサン、エーテルなどのエーテル類;酢酸エチルのようなエステル類;メタノール、エタノールのようなアルコール類;ぎ酸、酢酸のような有機酸類があげられるが、好適には、エタノールである。

使用される触媒としては、例えば、パラジウム/カーボン、水酸化パラジウム、水酸化パラジウム/カーボン、パラジウムブラックがあげられるが、好適には、水酸化パラジウム/カーボンである。

反応温度は、0乃至50℃であり、好適には、15乃至25℃である。

反応時間は、1時間乃至48時間であり、好適には、3時間乃至24時間である。 反応終了後、本反応の目的化合物(I)は常法に従って、反応混合物から採取され

118

る。例えば、反応混合物より触媒類を濾別し、得られた濾液を濃縮することによって 得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等により、精製することもできる。

②保護基がジフェニルメチル基である場合

保護基がジフェニルメチル基である場合は、上記①と同様に水素雰囲気下の接触還元を行うか、または、不活性溶剤中、酸で処理することにより達成される。

酸で処理する場合の使用される溶剤としては、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロインのような脂肪族炭化水素類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;メチレンクロリド、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類;酢酸エチル、酢酸プロピル、酢酸ブチル、炭酸ジエチルのようなエステル類;ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類;メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、イソアミルアルコールのようなアルコール類;アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノンのようなケトン類;水、又は、これらの混合溶剤が好適であり、更に好適には、ハロゲン化炭化水素類、エステル類又はエーテル類である。

使用される酸としては、通常、ブレンステッド酸又はルイス酸として使用されるものであれば特に限定はなく、好適には、塩酸、硫酸、硝酸のような無機酸;又は酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、pートルエンスルホン酸のような有機酸である。

反応温度及び反応時間は、出発物質、溶剤及び使用される酸の種類、濃度等により異なるが、通常は、-10 乃至 100 $^{\circ}$ (好適には、-5 乃至 50 $^{\circ}$)で、5 分乃至 48 時間(好適には、30 分乃至 10 時間)である。

反応終了後、本反応の目的化合物(I)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を中和した後、濃縮し、酢酸エチルのような水と混和しない 有機溶剤を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム 等で乾燥後、溶剤を留去することで得られる。 得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等により、精製することもできる。

③保護基がフェニル基である場合

保護基がフェニル基である場合は、不活性溶剤中、触媒存在下、接触還元することにより、脱保護することができる。

使用される溶剤としては、例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサン、エーテルなどのエーテル類;酢酸エチルのようなエステル類;メタノール、エタノールのようなアルコール類;ぎ酸、酢酸のような有機酸類があげられるが、好適には、テトラヒドロフランである。

使用される触媒は、好適には、酸化白金である。

反応温度は、0乃至50℃であり、好適には、15乃至25℃である。

反応時間は、1時間乃至48時間であり、好適には、1時間乃至24時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物(I)は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物より触媒類を濾別し、得られた濾液を濃縮することによって得られる。

得られた化合物は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー等により、精製することもできる。

④保護基がアリル基である場合

保護基がアリル基である場合は、不活性溶剤中、パラジウム触媒下、ギ酸ートリエチルアミン混合物で加水素分解することにより、化合物(XXIX)のアリル基を脱保護することができる。

本発明である、化合物(I)のエステルは、エステルを形成する基により、通常の 方法により製造することができる。必要に応じて、水酸基の保護、脱保護をエステル 化の前後でおこなう。

例えば、(1)所望のエステルを形成する基に対応するアルキルハライドを使用する方法、(2)所望のエステルを形成する基に対応するアルコールを使用する方法等があげられる。

(1)の方法において、使用される溶媒としては、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はないが、好適には、ヘキサン、ヘプタンのよ

うな脂肪族炭化水素類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;メチレンクロリド、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類;ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類;アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、イソホロン、シクロヘキサノンのようなケトン類;アセトニトリル、イソブチロニトリルのようなニトリル類;ホルムアミド、N, Nージメチルホルムアミド、N, Nージメチルアセトアミド、Nーメチルー2ーピロリドン、Nーメチルピロリジノン、ヘキサメチルホスホロトリアミドのようなアミド類を挙げることができる。

(1) の方法では、通常、塩基触媒を用い、その塩基触媒としては、通常の反応に おいて、塩基として使用されるものであれば、特に限定はないが、好適には、炭酸ナ トリウム、炭酸カリウム、炭酸リチウムのようなアルカリ金属炭酸塩類;炭酸水素ナ トリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素リチウムのようなアルカリ金属炭酸水素塩類: 水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属水素化物 類;水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化バリウム、水酸化リチウムのような アルカリ金属水酸化物類;弗化ナトリウム、弗化カリウムのようなアルカリ金属弗化 物類等の無機塩基類:ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムメト キシド、カリウムエトキシド、カリウム tertーブトキシド、リチウムメトキシドの ようなアルカリ金属アルコキシド類:メチルメルカプタンナトリウム、エチルメルカ プタンナトリウムのようなメルカプタンアルカリ金属類:Nーメチルモルホリン、ト リエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ジシクロヘキシ ルアミン、N-メチルピペリジン、ピリジン、4-ピロリジノピリジン、ピコリン、 4- (N, N-ジメチルアミノ) ピリジン、2, 6-ジ (tert-ブチル) -4-メチ ルピリジン、キノリン、N, N-ジメチルアニリン、N, N-ジエチルアニリン、1, 5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノナ-5-エン、1,4-ジアザビシクロ[2. 2. 2] オクタン (DABCO)、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデカ ー 7 ーエン(DBU)のような有機塩基類又はブチルリチウム、リチウムジイソプロ ピルアミド、リチウム ビス (トリメチルシリル) アミドのような有機金属塩基類を

挙げることができる。

- (1)の方法においては、通常、-20℃乃至120℃(好適には、0乃至80℃)で、0.5乃至10時間反応する。
 - (2) の方法では、通常、縮合剤を用い、その「縮合剤」としては、
- (a) ジエチルホスホリルシアニド、ジフェニルホスホリルアジド、シアノ燐酸ジエチルのような燐酸エステル類と下記塩基の組合せ;
- (b) 1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミド、1, 3-ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチルー3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド等のカルボジイミド類;前記カルボジイミド類と下記塩基の組合せ;前記カルボジイミド類とN-ヒドロキシスクシンイミド、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール、N-ヒドロキシー5-ノルボルネンー2, 3-ジカルボキシイミドのようなN-ヒドロキシ類の組合せ;
- (c) 2, 2'ージピリジル ジサルファイド、2, 2'ージベンゾチアゾリル ジサルファイドのようなジサルファイド類とトリフェニルホスフィン、トリブチルホスフィンのようなホスフィン類の組合せ;
- (d) N, N'ージスクシンイミジルカーボネート、ジー2ーピリジル カーボネート、S、S'ービス(1ーフェニルー1Hーテトラゾールー5ーイル) ジチオカーボネート のようなカーボネート類:
- (e) N, N'-ビス(2-オキソー3-オキサゾリジニル) ホスフィニッククロライドのようなホスフィニッククロライド類:
- (f) N, N'ージスクシンイミジルオキザレート、N, N'ージフタルイミドオキザレート、N, N'ービス(5- ノルボルネン- 2, 3-ジカルボキシイミジル)オキザレート、1, 1'-ビス(4 ングトリアグリル)オキザレート、1, 4 ービス(4 クロロベングトリアグリル)オキザレート、1, 4 ービス(4 ードリフルオロメチルベングトリアグリル)オキザレートのようなオキザレート類:
- (g)前記ホスフィン類とアゾジカルボン酸ジエチル、1,1'-(アゾジカルボニル)ジピペリジンのようなアゾジカルボン酸エステル又はアゾジカルボキシアミド類の組合せ;前記ホスフィン類と下記塩基の組合せ;
 - (h) N-エチル-5-フェニルイソオキサゾリウム-3'-スルホナートのようなN

- 低級アルキルー5-アリールイソオキサゾリウムー3'ースルホナート類;
- (i) ジー2-ピリジルジセレニドのようなジヘテロアリールジセレニド類;
- (j) pーニトロベンゼンスルホニルトリアゾリドのようなアリールスルホニルトリアゾリド類:
- (k) 2-クロル-1-メチルピリジニウム ヨーダイドのような2-ハロ-1-低級アルキルピリジニウム ハライド類;
- (1) 1, 1'ーオキザリルジイミダゾール、N, N'ーカルボニルジイミダゾールのようなイミダゾール類:
- (m) 3-エチル-2-クロローベンゾチアゾリウム フルオロボレートのような3-低級アルキル-2-ハロゲンーベンゾチアゾリウム フルオロボレート類;
- (n) 3-メチルーベンゾチアゾール-2-セロンのような3-低級アルキルーベン ゾチアゾール-2-セロン類;
- (o) フェニルジクロロホスフェート、ポリホスフェートエステルのようなホスフェート類:
- (p) クロロスルホニルイソシアネートのようなハロゲノスルホニルイソシアネート類:
- (q) トリメチルシリルクロリド、トリエチルシリルクロリドのようなハロゲノシラン類:
- (r) メタンスルホニルクロリドのような低級アルカンスルホニルハライドと下記塩 基の組合せ:
- (s) N, N, N', N'ーテトラメチルクロロホルマミジウムクロリドのようなN, N, N', N'ーテトラ低級アルキルハロゲノホルマミジウムクロリド類を挙げることができるが、好適には、カルボジイミド類、及び、ホスフィン類とアゾジカルボン酸エステル又はアゾジカルボキシアミド類の組合せである。
- (2)の方法において、使用される溶剤としては、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はないが、好適には、ヘキサン、ヘプタンのような脂肪族炭化水素類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;メチレンクロリド、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類;蟻酸エチル、酢酸エチル、酢酸プ

ロピル、酢酸ブチル、炭酸ジエチルのようなエステル類;ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類;アセトニトリル、イソブチロニトリルのようなニトリル類;ホルムアミド、N,Nージメチルホルムアミド、N,Nージメチルアセトアミド、Nーメチルー2ーピロリドン、Nーメチルピロリジノン、ヘキサメチルホスホロトリアミドのようなアミド類を挙げることができる。

(2)の方法では、塩基触媒を使用することもでき、その塩基触媒としては、通常の反応において塩基として使用されるものであれば、特に限定はないが、好適には、Nーメチルモルホリン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ジシクロヘキシルアミン、Nーメチルピペリジン、ピリジン、4ーピロリジノピリジン、ピコリン、4ー(N,Nージメチルアミノ)ピリジン、2,6ージ(tertーブチル)ー4ーメチルピリジン、キノリン、N,Nージメチルアニリン、N,Nージエチルアニリンのような有機塩基類を挙げることができる。

尚、4-(N, N-ジメチルアミノ) ピリジン、4-ピロリジノピリジンは、他の 塩基と組み合わせて、触媒量を用いることもでき、又、反応を効果的に行わせるため に、モレキュラー・シーブのような脱水剤、ベンジルトリエチルアンモニウムクロリ ド、テトラブチルアンモニウムクロリドのような第4級アンモニウム塩類、ジベンゾ -18-クラウン-6のようなクラウンエーテル類、3,4-ジヒドロ-2H-ピリ ド[1,2-a] ピリミジン-2-オンのような酸補足剤等を添加することもできる。 反応温度は、-20 ℃乃至80 ℃で行なわれるが、好適には、0 ℃乃至室温である。 反応時間は、主に反応温度、原料化合物、反応試薬又は使用される溶媒の種類によ って異なるが、通常、10分間乃至3日間で、好適には、30分間乃至1日間である。 特に、エステルを形成する基が、低級アルキル基の場合には、溶媒中(反応を阻害 せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はないが、好適には、試薬 と同一のアルコール; ヘキサン、ヘプタンのような脂肪族炭化水素類; ベンゼン、ト ルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;メチレンクロリド、クロロホルム、四 塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化 炭化水素類:ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジ オキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエー

テル類;アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、イソホロン、シクロへキサノンのようなケトン類;アセトニトリル、イソブチロニトリルのようなニトリル類;ホルムアミド、N,Nージメチルホルムアミド、N,Nージメチルアセトアミド、Nーメチルー2-ピロリドン、Nーメチルピロリジノン、ヘキサメチルホスホロトリアミドのようなアミド類を挙げることができ、好適には、試薬と同一のアルコールである。)、酸触媒の存在下(通常の反応において酸触媒として使用されるものであれば特に限定はないが、好適には、塩化水素、臭化水素酸、硫酸、過塩素酸、燐酸のような無機酸又は酢酸、蟻酸、蓚酸、メタンスルホン酸、パラトルエンスルホン酸、トリフルオロ酢酸、トリフルオロメタンスルホン酸のような有機酸等のブレンステッド酸或いはボロントリクロリド、ボロントリフルオリド、ボロントリブロミドのようなルイス酸又は、酸性イオン交換樹脂を挙げることができる。)、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのような対応するアルコールと、0℃乃至10℃(好適には、20℃乃至60℃)で、1時間乃至24時間反応させる方法である。

反応終了後、本反応の化合物(I)は常法に従って、反応混合物から採取される。 例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、水洗後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。

得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、又は、通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法、例えば、シリカゲル、アルミナ、マグネシウムーシリカゲル系のフロリジルのような担体を用いた吸着カラムクロマトグラフィー法;セファデックスLH-20(ファルマシア社製)、アンバーライトXAD-11(ローム・アンド・ハース社製)、ダイヤイオンHP-20(三菱化成社製)ような担体を用いた分配カラムクロマトグラフィー等の合成吸着剤を使用する方法、又は、シリカゲル若しくはアルキル化シリカゲルによる順相・逆相カラムクロマトグラフィー法(好適には、高速液体クロマトグラフィーである。)を適宜組合せ、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

本発明の化合物(I)の投与形態としては、例えば、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、

散剤若しくはシロップ剤等による経口投与又は注射剤若しくは坐剤等により非経口投与を挙げることができる。これらの製剤は、賦型剤、結合剤、崩壊剤、滑沢剤、安定剤、矯味矯臭剤等の添加剤を用いて、周知の方法で製造される。

その使用量は、症状、年齢等により異なるが、1日0.01乃至10mg/kg体 重を、通常成人に対して、1日1回又は数回に分けて投与することができる。

[発明を実施するための最良の形態]

以下、実施例、参考例及び試験例をあげて、本発明を、さらに詳細に説明するが、 本発明はこれに限定されるものではない。

(実施例1)

<u>カルボキシメチル 6-O-[2-アセタミド-2-デオキシ-3-O-{(R)</u> -3-ドデシルオキシテトラデシル} -4-O-ホスホノー $\beta-D-$ グルコピラノシル] -2-デオキシー2- {(R) -3-ヒドロキシテトラデカナミド} -3-O-{(R) -3-ヒドロキシテトラデシル} $-\alpha-$ D-グルコピラノシド (例示化合物 7 5)

参考例 24 の化合物 55mg (0.037mmo1)のテトラヒドロフラン 5mL 溶液に、酸化白金 28mg を加えて、水素雰囲気下で室温にて 20 時間攪拌した。反応液を濾過し、減圧下 濃縮したのち、得られた残査をクロロホルム 5mL、メタノール 10mL、 0.1N 塩酸水溶液 4mL に溶解し、さらにクロロホルム 5mL、0.1N 塩酸水溶液 5mL を加えて洗浄した。 クロロホルム層を取り、減圧下溶媒を留去すると、白色固体として、目的化合物 49mg (収率:98%) が得られた。

m. p. 194. 0-196. 5°C; $[\alpha]_{p}^{23}$ -13. 0° (c=0. 25, CHCl₃);

IR ν_{max} (KBr) 3289 (broad), 3087, 2923, 2853, 1733, 1654 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CD₃OD:CDCl₃=1:1) δ 4.77 (d, 1H, J=2.9 Hz), 4.61 (d, 1H, J=4.9 Hz), 4.25, 4.08 (ABq, 2H, J=16.6 Hz), 4.15-4.05 (m, 3H), 3.98 (m, 1H), 3.87-3.86 (m, 5H), 3.71-3.61 (m, 6H), 3.54 (t, 1H, J=10.7-8.8 Hz), 3.47-3.39 (m, 5H), 2.43-2.30 (m, 2H), 2.01 (s, 3H), 1.88-1.74 (m, 2H), 1.55-1.16 (m, 82H), 0.89 (t, 12H, J=6.8 Hz);

126

MS (FAB, positive) m/z 1361 (M+Na), 1339 (M+H);

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{70}H_{135}N_2O_{19}PNa$: 1361. 9294; Found: 1361. 9294. Anal. Calcd. for $C_{70}H_{135}N_2O_{19}P$ (1339. 8): C, 62. 75; H, 10. 16; N, 2. 09; P, 2. 31. Found: C, 62. 16; H, 9. 98; N, 2. 03; P, 2. 21.

(実施例2)

カルボキシメチル $6-O-[2-アセタミド-2-デオキシ-3-O-\{(R)-3-ドデシルオキシテトラデシル}-6-O-メチル-4-O-ホスホノ-<math>\beta-D$ -グルコピラノシル] $-2-デオキシ-2-\{(R)-3-ヒドロキシテトラデカナミド\}-3-O-\{(R)-3-ヒドロキシテトラデシル\}-\alpha-D-グルコピラノシド (例示化合物 <math>1$ 3)

参考例 25 の化合物 113mg (0.075mmo1) について、実施例 1 と同様の操作を行うことにより、白色固体として目的化合物 102mg (定量的) が得られた。

m. p. 199.0-201.0°C;

 $[\alpha]_{D}^{23}$ +8.3° (c=0.25, CHCl₃);

IR ν_{max} (KBr) 3283 (broad), 3091, 2924, 2854, 1734, 1655 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CD₃0D:CDC1₃=5:1) δ 4.78 (d, 1H, J=3.4 Hz), 4.58 (d, 1H, J=8.2 Hz), 4.24, 4.07 (ABq, 2H, J=16.7 Hz), 4.11-3.93 (m, 4H), 3.91-3.81 (m, 4H), 3.75-3.52 (m, 9H), 3.46-3.35 (m, 7H, containing s, 3H, δ 3.41), 2.41 (dd, 1H, J=3.7, 14.6 Hz), 2.34 (dd, 1H, J=8.6, 14.6 Hz), 2.01 (s, 3H), 1.83-1.75 (m, 2H), 1.59-1.28 (m, 82H), 0.89 (t, 12H, J=6.8 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 1375 (M+Na)⁺, 1353 (M+H)⁺;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{71}H_{137}N_2O_{19}PNa$: 1375. 9451; Found: 1375. 9497. Anal. Calcd. for $C_{71}H_{137}N_2O_{19}P$ (1353. 8): C, 62. 99; H, 10. 20; N, 2. 07; P, 2. 29. Found: C, 62. 70; H, 10. 37; N, 1. 92; P, 2. 11.

(実施例3)

 $\frac{D \nu \vec{x}$ キシメチル $6-O-[2-P t 9 ミ F-2, 6-ジデオキシ-3-O-] { (R) <math>-3-F$ デシルオキシテトラデシル} $-6-D \nu \vec{x}$ $-6-D \nu \vec{x}$

 $\beta-D-$ グルコピラノシル] -2-デオキシ-2- { (R) -3-ヒドロキシテトラ デカナミド} -3-O- { (R) -3-ヒドロキシテトラデシル} $-\alpha-$ D-グルコ ピラノシド (例示化合物 1 3 7)

参考例 26 の化合物 85mg (0.057mmol) について、実施例 1 と同様の操作を行うことにより、白色固体として目的化合物 77mg (定量的) が得られた。

m. p. 215. 0-217. 0°C;

 $[\alpha]_{n}^{24} +19.1^{\circ} \text{ (c=0.25, CHCl}_{3});$

IR ν_{max} (KBr) 3280 (broad), 3093, 2924, 2854, 1733, 1654 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CD₃OD:CDCl₃=5:1) δ 4.78 (d, 1H, J=3.3 Hz), 4.63 (d, 1H, J=7.6 Hz), 4.71-4.56 (m, 2H), 4.25, 4.08 (ABq, 2H, J=16.8 Hz), 4.14-3.95 (m, 5H), 3.92-3.75 (m, 4H), 3.69-3.61 (m, 5H), 3.55 (t, 1H, J=9.3-10.2 Hz), 3.47-3.38 (m, 4H), 2.41 (dd, 1H, J=3.8, 14.6 Hz), 2.34 (dd, 1H, J=8.7, 14.6 Hz), 2.01 (s, 3H), 1.83-1.71 (m, 2H), 1.59-1.20 (m, 82H), 0.89 (t, 12H, J=6.8 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 1363 (M+Na)⁺, 1341 (M+H)⁺;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z : Calcd. for $C_{70}H_{134}FN_2O_{18}PNa$: 1363. 9251; Found: 1363. 9291. Anal. Calcd. for $C_{70}H_{134}N_2O_{18}FP$ (1341. 8): C, 62. 66; H, 10. 07; N, 2. 09; F, 1. 42; P, 2. 31. Found: C, 62. 58; H, 10. 05; N, 1. 95; F, 1. 34; P, 2. 14.

(実施例4)

参考例 56の化合物(35 mg、0.024 mm o 1)のテトラヒドロフラン(2 mL)溶液に、トリフェニルホスフィン(3.1 mg、0.012 mm o 1)、トリエチルアミン(16μ L、0.114 mm o 1)、ギ酸(10μ L、0.265 mm o 1)、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(0.3 mg、0.003 mm o 1)を加えて、50 で 5 時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、DEAEセルロース(酢酸型)カラムクロマトグラフィーにて精製し、0.05 M酢酸アンモニウム溶液(0.05 M酢酸

ロロホルム:メタノール:水、2:3:1)で溶出した。クロロホルム4mL、メタノール8mL、0.1 N塩酸水溶液3.2mLに溶解し、さらにクロロホルム4mL、0.1 N塩酸水溶液4mLを加えて洗浄し、クロロホルム層を取り、減圧下溶媒を留去すると、白色固体として目的化合物(19.1mg、収率:63%)が得られた。m.p. 177.5-179.0°C; [α]₀²⁴-3.0 (c 0.35, CHCl₃); IR (KBr) ν_{max} 3298 (broad), 3071, 2925, 2854, 1719, 1651 cm⁻¹., ¹H-NMR (500 MHz, CD₃0D: CDCl₃=5:1) ™:0.89 (12H, t, J=6.9 Hz), 1.28-1.65 (68H, m), 1.74-1.78 (2H, m), 2.01-2.04 (4H, m), 2.23 (2H, t, J=7.2-8.3 Hz), 2.58 (2H, t, J=7.3 Hz), 3.30-3.35 (4H, m, containing 3H, s, at 3.32 ppm), 3.38-3.43 (3H, m), 3.51 (1H, t, J=9.0, 10.4 Hz), 3.58-3.88 (11H, m), 4.00-4.14 (3H, m), 4.05, 4.26 (2H, ABq, J=16.6 Hz), 4.63 (1H, d, J=7.8 Hz), 4.75 (1H, d, J=3.6 Hz), 5.31-5.37 (2H, m); MS (FAB, positive) m/z 1315 (M+K)⁺; 1299 (M+Na)⁺; 1277 (M+H)⁺; MS (FAB, negative) m/z 1275 (M-H)⁻; High Resolution MS (FAB, negative) m/z: calcd. for C₆₇H₁₂₄N₂O₁₈P: 1275.8587; found: 1275.8611.

(実施例5)

<u>カルボキシメチル 3-O-デシルー2-デオキシー6-O-[2-デオキシー3-O-[(R)-3-メトキシデシル]-6-O-メチルー2-[(Z)-11-オクタデセナミド]-4-O-ホスホノー β -D-グルコピラノシル]-2-(3-オキソテトラデカナミド)- α -D-グルコピラノシド</u>

参考例 5 7 の化合物 (40.5 mg、0.029 mm o 1) について、実施例 4 と 同様の操作を行うことにより、白色固体として目的化合物 (31.2 mg、収率:84%) が得られた。

m. p. 175. 5-178. 0 °C; [α]_D²⁴ +21. 3 (CHCl₃, c 0. 32); IR(KBr) ν _{max} 3297 (broad), 3080, 2925, 2854, 1720 1647 cm⁻¹., ¹H-NMR (500 MHz, CD₃OD: CDCl₃=5:1) TM: 0. 89 (12H, t, J=6.7 Hz), 1. 28-1. 66 (68H, m), 1. 75 (2H, q, J=6.6 Hz), 2. 01-2. 04 (4H, m), 2. 22-2. 25 (2H, m), 2. 58 (2H, t, J=7.3 Hz), 3. 30-3. 34 (5H, m, containing 3H, s, at 3. 31 ppm), 3. 38-3. 42 (5H, m, containing 3H, s, at 3. 40 ppm), 3. 45-3. 87 (12H, m), 4. 01-4. 16 (3H, m), 4. 06, 4. 26 (2H, ABq, J=16.6 Hz), 4. 58 (1H, d, J=8. 2 Hz), 4. 75 (1H, d, J=3.6 Hz), 5. 31-5. 37 (2H, m); MS (FAB, positive) m/z 1329 (M+K)⁺;

129

1313 (M+Na)⁺; 1291 (M+H)⁺; MS (FAB, negative) m/z 1289 (M-H)⁻; High Resolution MS (FAB, negative) m/z: calcd for $C_{68}H_{127}N_2O_{18}P$: 1289.8743; found: 1289.8801.

(実施例6)

<u>カルボキシメチル 6-O-[2-デオキシ-2-ホルムアミド-4-O-ホスホ</u> $J-3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]テトラデシル]-<math>\beta$ $-D-グルコピラノシル]-2-デオキシ-3-O-ドデシル-2-(3-オキソテトラデカナミド) <math>-\alpha-D-$ グルコピラノシド (例示化合物 1 5 5 1)

参考例76の化合物(171mg、0.113mmol)のテトラヒドロフラン(5 mL)溶液に、トリフェニルホスフィン(14.8mg、0.056mmol)、トリ エチルアミン $(79 \mu L, 0.567 mmol)$ 、ギ酸 $(43 \mu L, 1.14 mmol)$ 、 テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(6.5mg、0.006mmol) を加えて、50℃で5時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、DEAEセルロース(酢 酸型)カラムクロマトグラフィーにて精製し、O.O5M酢酸アンモニウム溶液(ク ロロホルム:メタノール:水、2:3:1)で溶出した。クロロホルム5mL、メタ ノール10mL、0.1N塩酸水溶液4mLに溶解し、さらにクロロホルム5mL、 O. 1 N塩酸水溶液 5 m L を加えて洗浄し、クロロホルム層を取り、減圧下溶媒を留 去すると、白色固体として目的化合物(118mg、収率:80%)が得られた。 m. p. 194.5-196.0 °C; [α]_D²⁵ -10.6 (c 0.23, CHCl₃); IR (KBr) ν _{max} 3305 (broad), 3070, 2924, 2853, 1713, 1663 cm⁻¹., ^{1}H -NMR (500 MHz, CD₃0D: CDCl₃=5:1) δ :0.89 (12H, t, J=6.9 Hz), 1.20-1.60 (74H, m), 1.72-1.79 (2H, m), 1.98-2.04 (4H, m), 2.58 (2H, t, J=7.4 Hz), 3.21 (1H, m), 3.36-3.47 (7H, m, containing 2H, s, at 3.41 ppm), 3.51 (1H, t, J=9.0, 10.5 Hz), 3.46-3.99 (10H, m), 4.02-4.17 (4H, m, containing 1H, ABq, J=16.6 Hz), 4.26 (1H, ABq, J=16.6 Hz), 4.40 (0.4H, d, J=8.3 Hz, cis), 4.60 (0.6H, d, J=8.3 Hz, trans), 4.76 (1H, d, J=3.7 Hz), 5.34-5.39 (2H, m), 7.97 (0.4H, s, CHO, cis), 8.16 (0.6H, s, CHO, trans); MS (FAB, positive) m/z 1343 $(M+K)^+$; 1327 $(M+Na)^+$; MS (FAB, negative) m/z 1303 $(M-H)^-$; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd for $C_{69}H_{129}N_2O_{18}PNa$: 1327.8876; found: 1327.8855. Anal. Calcd. for $C_{69}H_{129}N_2O_{18}P$ (1305. 7): C, 63. 47; H, 9. 96; N, 2. 15; P, 2. 37. Found: C,

÷

PCT/JP01/03005

130

64. 24; H, 10. 08; N, 2. 12; P, 2. 29.

(実施例7)

WO 01/77133

<u>カルボキシメチル 6-O-[2-アセタミド-2-デオキシー4-O-ホスホノ</u> -3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]テトラデシル]-β- D-グルコピラノシル]-2-デオキシ-3-O-ドデシル-2-(3-オキソテトラ $デカナミド) <math>-\alpha-D-グルコピラノシド$ (例示化合物 1587)

参考例77の化合物(170mg、0.112mmo1)について、実施例6と同様の操作を行うことにより、目的化合物(137mg、収率:92%)が得られた。 m. p. 191.5-192.5 °C; $[\alpha]_D^{25}$ -2.4 (c 0.21, CHCl $_3$); IR (KBr) ν max 3286 (broad), 3084, 2924, 2853, 1719, 1652 cm $^{-1}$., 1 H-NMR (500 MHz, CD $_3$ OD: CDCl $_3$ =5:1) δ : 0.90 (12H, t, J=6.9 Hz), 1.28-1.58 (74H, m), 1.72-1.76 (2H, m), 1.98-2.04 (7H, m, containing 3H, s, at 2.01 ppm), 2.58 (2H, t, J=7.3 Hz), 3.42-3.90 (18H, m), 4.00-4.15 (4H, m, containing 1H, ABq, J=16.6 Hz, at 4.09 ppm), 4.26 (1H, ABq, J=16.6 Hz), 4.55 (1H, d, J=8.3 Hz), 4.77 (1H, d, J=3.5 Hz), 5.33-5.38 (2H, m); MS (FAB, positive) m/z 1357 (M+K) $^+$; 1341 (M+Na) $^+$; 1319 (M+H) $^+$; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd.for $C_{70}H_{131}N_2O_{18}P$ Na: 1341.9032; found: 1341.9011. Anal. Calcd.for $C_{70}H_{131}N_2O_{18}P$ (1319.8): C, 63.70; H, 10.01; N, 2.12; P, 2.35. Found: C, 62.62; H, 10.23; N, 2.22; P, 2.28

(実施例8)

参考例 78 の化合物(145 m g、0.101 m m o 1)について、実施例 6 と同様の操作を行うことにより、目的化合物(107 m g、収率:80%)が得られた。 m. p. 180.0-181.5 °C; $[\alpha]_0^{25}$ +24.3(c0.22, $CHCl_3$); IR(KBr) ν_{max} 3297(broad),

2924, 2853, 1718, 1662, 1639 cm⁻¹., ¹H-NMR (500 MHz, CD₃OD: CDCl₃=5:1) δ : 0.90 (12H, t, J=6.9 Hz), 1.28-1.55 (74H, m), 1.69-1.79 (2H, m), 1.97-2.03 (4H, m), 2.58 (2H, t, J=7.3 Hz), 3.21 (1H, m), 3.35-3.95 (20H, m, containing 3H, s, at 3.40 ppm), 4.01-4.16 (4H, m, containing 1H, ABq, J=16.7 Hz, at 4.09 ppm), 4.26 (1H, ABq, J=16.7 Hz), 4.41 (1/3H, d, J=8.3 Hz), 4.57 (2/3H, d, J=8.3 Hz), 4.77 (1H, d, J=3.8 Hz), 5.31-5.38 (2H, m), 7.97 (1/3H, s, CH0, cis), 8.16 (2/3H, s, CH0, trans); MS (FAB, positive) m/z 1357 (M+K)⁺; 1341 (M+Na)⁺; 1319 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{70}H_{131}N_2O_{18}PNa$: 1341.9032; found: 1341.9044. Anal. Calcd. for $C_{70}H_{131}N_2O_{18}P$ (1319.8): C, 63.70; H, 10.01; N, 2.12; P, 2.35. Found: C, 62.18; H, 10.12; N, 2.19; P, 2.19.

(実施例9)

カルボキシメチル 6-0-[2-アセタミド-2-デオキシ-6-0-メチルー 4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]テトラデシル] - β - D - グルコピラノシル] - 2 - デオキシ - 3 - O - ドデシル - 2 -(3-オキソテトラデカナミド) - α-D-グルコピラノシド (例示化合物 1 5 8 8) 参考例79の化合物(100mg、0.069mmol)について、実施例6と同 様の操作を行うことにより、目的化合物(83mg、収率:91%)が得られた。 m. p. 177. 5-179. 5 °C; $[\alpha]_0^{25}$ +17. 2 (c 0.18, CHCl₃); IR (KBr) ν_{max} 3294 (broad), 3070, 2924, 2853, 1718, 1653 cm⁻¹., ¹H-NMR (500 MHz, CD₃OD: CDCl₃=5:1) δ : 0. 90 (12H, t, J=6.6-7.3 Hz), 1.27-1.54 (74H, m), 1.73-1.75 (2H, m), 1.98-2.08 (7H, m, containing 3H, s, at 2.00 ppm), 2.58 (2H, t, J=7.3 Hz), 3.32-3.85 (21H, m, containing 3H, s, at 3.39 ppm), 4.00 (1H, dd, J=3.7, 11.0 Hz), 4.05-4.11 (3H, m, containing 1H, ABq, J=16.8 Hz, at 4.09 ppm), 4.26 (1H, ABq, J=16.8 Hz), 4.54 (1H, d, J=8.8 Hz), 4.77 (1H, d, J=3.7 Hz), 5.33-5.38 (2H, m); MS (FAB, positive) m/z 1371 $(M+K)^+$; 1355 $(M+Na)^+$; 1333 $(M+H)^+$; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{71}H_{133}N_2O_{18}PNa$: 1355.9189; found: 1355.9181. Anal. Calcd. for $C_{71}H_{133}N_2O_{18}P$ (1333.8): C, 63.94; H, 10.05; N, 2.10; P, 2.32. Found: C, 62.53; H, 9.81; N, 2.21; P, 2.21.

(参考例1)

Tリル $3-O-\{(R)-3-$ ベンジルオキシテトラデシル $\}-2-$ デオキシー 4, 6-O-イソプロピリデン-2-トリフルオロアセタミド $-\alpha-D-$ グルコピラ ノシド

原料のアリル 2-デオキシ-4, $6-O-イソプロピリデン-2-トリフルオロアセタミド-\alpha-D-グルコピラノシド 3.53g(9.93mmo1)のジメチルホルムアミド40mL 溶液に、<math>0$ ℃で水素化ナトリウム 482mg(60%油性、12.0mmo1)を加えて、1.5 分撹拌した。別途合成した(R)-3 -ベンジルオキシ-1 -メタンスルホニルオキシテトラデカン 3.31g(8.30mmo1)を加え、室温で6時間撹拌した。水を加えて反応を止め、酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン一酢酸エチル(<math>4:1)で溶出すると、目的化合物 4.05g(収率:74%)が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 3430, 2928, 2856, 1734 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CDC1₃) δ 7. 34-7. 26 (m, 5H), 6. 42 (d, 1H, J=9.5 Hz, NH), 5. 87 (m, 1H), 5. 31-5. 25 (m, 2H), 4. 86 (d, 1H, J=3. 7 Hz), 4. 51, 4. 42 (ABq, 2H, J=11. 7 Hz), 4. 20-4. 14 (m, 2H), 3. 98 (dd, 1H, J=5. 9, 12. 5 Hz), 3. 91-3. 84 (m, 2H), 3. 75 (t, 1H, J=10. 3 Hz), 3. 69-3. 66 (m, 2H), 3. 59 (m, 1H), 3. 49-3. 43 (m, 2H), 1. 75-1. 51 (m, 4H), 1. 48 (s, 3H), 1. 40 (s, 3H), 1. 26 (brs, 18H), 0. 88 (t, 3H, J=6. 6 Hz); MS (FAB, positive) m/z 696 (M+K)⁺, 658 (M+H)⁺;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{35}H_{55}F_3NO_7$: 658. 3931; Found: 658. 3904. Anal. Calcd. for $C_{35}H_{54}F_3NO_7$ (657. 8): C, 63. 91; H, 8. 28; N, 2. 13; F, 8. 66. Found: C, 64. 09; H, 8. 30; N, 2. 11; F, 8. 46.

(参考例2)

参考例1の化合物 2.73g(4.15mmol)をエタノール 10mL に溶解し、1M水酸化ナト

リウム水溶液 10mL を加えて、60 Cにて加熱攪拌した。5 時間後、この反応液を酢酸 エチルで希釈し、水、飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶 媒を留去し、ポンプで乾燥すると、アミン 2.34g が得られた。このアミンを塩化メチレン 15mL に溶解し、(R)-3 -ベンジルオキシテトラデカン酸 1.67g(5.00mmo1)、ジシクロヘキシルカルボジイミド 1.28g(6.20mmo1)、4 -ジメチルアミノピリジン、759mg(6.21mmo1)を加えて室温で 1 8 時間攪拌した。反応液を濾過し、減圧下濃縮して、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン一酢酸エチル(4:1)で溶出すると、目的化合物 3.25g(収率:89%)が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 3441, 3363, 2928, 2856, 1666 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 7. 35-7. 26 (m, 10H), 6. 40 (d, 1H, J=9.5 Hz, NH), 5. 77 (m, 1H), 5. 23-5. 12 (m, 2H), 4. 78 (d, 1H, J=3. 7 Hz), 4. 54, 4. 51 (ABq, 2H, J=11. 0 Hz), 4. 47, 4. 45 (ABq, 2H, J=11. 0 Hz), 4. 20 (td, 1H, J=9.5, 3. 7 Hz), 4. 04 (dd, 1H, J=5.9, 12.5 Hz), 3. 85-3. 61 (m, 7H), 3. 56-3. 45 (m, 2H), 3. 40 (t, 1H, J=10. 3 Hz), 2. 43 (dd, 1H, J=3. 7, 14. 6 Hz), 2. 32 (dd, 1H, J=7. 3, 14. 6 Hz), 1. 81-1. 24 (m, 48H, containing s, 3H, δ 1. 46, s, 3H, δ 1. 38), 0. 88 (t, 6H, J=6. 6-7. 3 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 916 (M+K), 900 (M+Na), 878 (M+H);

High Resolution MS (FAB, positive) m/z : Calcd. for $C_{54}H_{88}NO_8$: 878. 6510; Found: 878. 6506. Anal. Calcd. for $C_{54}H_{87}NO_8$ (878. 3): C, 73. 85; H, 9. 99; N, 1. 60. Found: C, 74. 54; H, 10. 06; N, 1. 65.

(参考例3)

参考例 2 の化合物 2.80g (3.19mmol)をテトラヒドロフラン 10mL、tert-ブタノール 10mL、tert-ブタノール 10mL、tert-ブタノール Nーオキシド 1.12g (9.56mmol) と四酸化オスミウム 6.5mL (2.5wt% tert-ブタノール溶液、0.518mmol)を加えて、室温で3時間攪拌した。この溶液に、飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加えて反応を止め、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和食塩水で

洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、真空ポンプで乾燥したのち、得られた残査をさらにベンゼン 20mL に溶解した。この溶液に、四酢酸鉛 1.88g(3.82mmol)を加えて、室温で1時間攪拌した。反応終了後、シリカゲルショートカラムにて濾過し、酢酸エチルで溶出して減圧下濃縮すると、アルデヒド 2.62g が得られた。さらに、このアルデヒドをtertーブタノール 16mL、水 4mL に溶解し、リン酸二水素ナトリウム二水和物 561mg(3.60mmol)、亜塩素酸ナトリウム 1.05g(9.17mmol)、2ーメチルー2ーブテン 1.06g(15.1mmol)を加えて室温で3時間攪拌した。反応終了後、この溶液に1N塩酸水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去すると、カルボン酸が得られた。さらに、このカルボン酸を酢酸エチル 20mL に溶解し、ジフェニルジアゾメタン 1.15g(5.92mmol)を加えて室温で18時間攪拌した。その後、酢酸を加えて反応を止め、反応液を減圧下濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(9:1、7:3)で溶出すると、目的化合物 2.57g(収率:76%)が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 3692, 3360, 2927, 2855, 1755, 1666 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 7.36-7.19 (m, 20H), 6.91 (s, 1H), 6.74 (d, 1H, J=9.5 Hz, NH), 4.73 (d, 1H, J=3.7 Hz), 4.46 (s, 2H), 4.44 (s, 2H), 4.22 (td, 1H, J=10.3, 3.7 Hz), 4.01 (s, 2H), 3.84-3.63 (m, 6H), 3.57-3.38 (m, 3H), 2.43 (dd, 1H, J=4.4, 14.6 Hz), 2.36 (dd, 1H, J=6.6, 14.6 Hz), 1.79-1.25 (m, 48H, containing s, 3H, δ 1.44, s, 3H, δ 1.36), 0.88 (t, 6H, J=6.6 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 1100 $(M+K)^+$, 1084 $(M+Na)^+$, 1062 $(M+H)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{66}H_{96}NO_{10}$: 1062.7034; Found: 1062.7009. Anal. Calcd. for $C_{66}H_{95}NO_{10}$ (1062.5): C, 74.61; H, 9.01; N, 1.32. Found: C, 74.26; H, 8.72; N, 1.35.

(参考例4)

PCT/JP01/03005

参考例3の化合物 2.35g(2.21mmo1)を80%酢酸水溶液に溶解し、60℃で4時間 攪拌した。反応終了後、反応液を減圧下濃縮して、酢酸エチルで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン一酢酸エチル(2:3)で溶出すると、白色固体として目的化合物 1.95g(収率:86%)が得られた。

135

IR ν_{max} (KBr) 3319, 3065, 3033, 2925, 2854, 1756, 1642 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CDC1₃) δ 7. 37-7. 20 (m, 20H), 6. 92 (s, 1H), 6. 83 (d, 1H, J=9. 5 Hz, NH), 4. 74 (d, 1H, J=3. 7 Hz), 4. 48-4. 40 (m, 4H), 4. 19 (td, 1H, J=10. 3, 3. 7 Hz), 4. 06 (s, 2H), 3. 84 (m, 1H), 3. 75-3. 62 (m, 4H), 3. 56-3. 46 (m, 3H), 3. 40 (t, 1H, J=9. 5 Hz), 2. 43-2. 40 (m, 2H), 1. 78-1. 26 (m, 42H), 0. 88 (t, 6H, J=6. 6 Hz); MS (FAB, positive) m/z 1060 (M+K)⁺, 1044 (M+Na)⁺, 1022 (M+H)⁺;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{63}H_{91}NO_{10}K$: 1060. 6280; Found: 1060. 6273. Anal. Calcd. for $C_{63}H_{91}NO_{10}$ (1022. 4): C, 74.01; H, 8.97; N, 1.37. Found: C, 73.82; H, 8.90; N, 1.48.

(参考例5)

WO 01/77133

Yリル $2-\vec{r}$ オキシー $3-O-\{(R)-3-\vec{r}$ デシルオキシテトラデシル $\}-4$, 6-O-4ソプロピリデン-2-トリフルオロアセタミド $-\alpha-D-$ グルコピラノシド

原料のアリル 2-デオキシ-4, $6-O-イソプロピリデン-2-トリフルオロアセタミド-\alpha-D-グルコピラノシド 4.23g(11.9mmo1)のジメチルホルムアミド 60mL 溶液に、<math>0$ で水素化ナトリウム 725mg(60%油性、18.1mmo1)を加えて、30分撹 伴した。別途合成した(R)-3-(ドデシルオキシ)-1-メタンスルホニルオキシテトラデカン <math>6.80g(14.3mmo1)を加え、室温で3時間撹拌した。水を加えて反応を止め、酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(4:1)で溶出すると、目的化合物 6.60g(収率:75%)が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 3431, 2928, 2855, 1734 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 6.55 (d, 1H, J=9.5 Hz, NH), 5.86 (m, 1H), 5.31-5.24 (m, 2H), 4.89 (d, 1H, J=3.7 Hz), 4.20-4.13 (m, 2H), 3.98 (dd, 1H, J=5.1, 12.5 Hz), 3.89-3.83 (m, 2H), 3.78-3.67 (m, 3H), 3.58-3.49 (m, 2H), 3.41-3.29 (m, 3H), 1.67-1.21 (m, 48H, containing s, 3H, δ1.51, s, 3H, δ1.41), 0.88 (t, 6H, J=6.6 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 774 $(M+K)^+$, 736 $(M+H)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{40}H_{73}F_3NO_7$: 736.5339; Found: 736.5337. Anal. Calcd. for $C_{40}H_{72}F_3NO_7$ (736.0): C, 65.28; H, 9.86; N, 1.90; F, 7.74. Found: C, 65.35; H, 9.89; N, 1.90; F, 7.86.

(参考例6)

参考例 5 の化合物 4.70g (6.39 mmo 1) をエタノール 10 mL に溶解し、1 M水酸化ナトリウム水溶液 10 mL を加えて、8 0 $^{\circ}$ で4 時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、酢酸エチルで希釈して、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、真空ポンプで乾燥すると、アミン 4.02g が得られた。このアミンを塩化メチレン 10 mL に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 10 mL、クロロギ酸 2, 2, 2 ートリクロロエチル 1.60g (7.55 mmo 1) を加えて、室温で 1 時間攪拌した。その後、塩化メチレンで希釈し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン一酢酸エチル (4:1) で溶出すると、目的化合物 4.54g (収率:87%) が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 3439, 2928, 2855, 1743 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 5.89 (m, 1H), 5.32-5.22 (m, 3H, containing NH), 4.87 (d, 1H, J=3.7 Hz), 4.74 (s, 2H), 4.13 (dd, 1H, J=5.9, 12.5 Hz), 3.98 (dd, 1H, J=6.6, 12.5 Hz), 3.92-3.82 (m, 3H), 3.77-3.57 (m, 4H), 3.48-3.30 (m, 4H), 1.68-1.21 (m, 48H, containing s, 3H, δ 1.50, s, 3H, δ 1.41), 0.88 (t, 6H, J=6.6-7.3 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 852 $(M+K)^+$, 814 $(M+H)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{41}H_{75}Cl_3NO_8$: 814. 4558; Found: 814. 4551. Anal. Calcd. for $C_{41}H_{74}Cl_3NO_8$ (815. 4): C, 60. 39; H, 9. 15; N, 1. 72; Cl, 13. 04. Found: C, 59. 84; H, 9. 04; N, 1. 70; Cl, 12. 89.

(参考例7)

 $PJN 2-デオキシ-3-O-\{(R)-3-ドデシルオキシテトラデシル}-2-(2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ) <math>-\alpha-D-グルコピラノ$ シド

参考例 6 の化合物 3.51g (4.30 mmo 1) を 8 0 %酢酸水溶液 20 mL に溶解し、6 0 $^{\circ}$ で 4 時間攪拌した。反応終了後、この溶液を減圧下濃縮し、酢酸エチルで希釈して、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン一酢酸エチル(3:2)で溶出すると、目的化合物 3.15g (収率:95%) が得られた。

IR ν_{max} (KBr) 3335, 2923, 2853, 1709 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 5.90 (m, 1H), 5.32-5.22 (m, 3H, containing NH), 4.87 (d, 1H, J=3.7 Hz), 4.81, 4.69 (ABq, 2H, J=11.7 Hz), 4.19 (dd, 1H, J=5.1, 13.2 Hz), 3.99 (dd, 1H, J=6.6, 13.2 Hz), 3.91-3.60 (m, 8H, containing OH), 3.50-3.36 (m, 4H), 2.17 (t, 1H, OH), 1.73-1.26 (m, 42H), 0.88 (t, 6H, J=6.6 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 812 (M+K)⁺, 796 (M+Na)⁺, 774 (M+H)⁺;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{38}H_{71}Cl_3NO_8$: 774. 4245; Found: 774. 4228. Anal. Calcd. for $C_{38}H_{70}Cl_3NO_8$ (775. 3): C, 58. 87; H, 9. 10; N, 1. 81; Cl, 13. 72. Found: C, 58. 87; H, 8. 94; N, 1. 81; Cl, 14. 00.

(参考例8)

 $P J N 6 - O - \alpha - \lambda U N J + \lambda U N J U$

参考例7の化合物 526mg(0.678mmol)の塩化メチレン 5mL 溶液に、ベンジルオキシ

WO 01/77133

カルボニルクロリド 0.50mL (3.50mmol) とピリジン 332mg (4.20mmol) を加えて、0 $\mathbb C$ で 3 時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン一酢酸エチル (3:1) で溶出すると、目的化合物 581mg (収率:94%) が得られた。

IR ν_{max} (KBr) 3522, 3329, 2923, 2853, 1725, 1709 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 7. 40-7. 32 (m, 5H), 5. 87 (m, 1H), 5. 30-5. 20 (m, 3H, containing NH), 5. 18 (s, 2H), 4. 85 (d, 1H, J=3. 7 Hz), 4. 81, 4. 68 (ABq, 2H, J=12. 5 Hz), 4. 46-4. 39 (m, 2H), 4. 15 (dd, 1H, J=5. 1, 12. 5 Hz), 3. 96 (dd, 1H, J=6. 6, 12. 5 Hz), 3. 88 (td, 1H, J=10. 3, 3. 7 Hz), 3. 84-3. 79 (m, 2H), 3. 69 (m, 1H), 3. 64 (brs, 1H, 0H), 3. 56 (m, 1H), 3. 48-3. 33 (m, 4H), 1. 74-1. 71 (m, 2H), 1. 59-1. 21 (m, 40H), 0. 88 (t, 6H, J=6. 6 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 946 $(M+K)^+$, 908 $(M+H)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{46}H_{77}Cl_3NO_{10}$: 908. 4613; Found: 908. 4592. Anal. Calcd. for $C_{46}H_{76}Cl_3NO_{10}$ (909. 5): C, 60. 75; H, 8. 42; N, 1. 54; Cl, 11. 70. Found: C, 60. 44; H, 8. 17; N, 1. 56; Cl, 11. 63.

(参考例9)

rリル 6-O-ベンジルオキシカルボニル-2-デオキシ-4-O-ジフェニル $ホスホノ-3-O-{(R)-3-ドデシルオキシテトラデシル}-2-(2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ)-<math>\alpha$ -D-グルコピラノシド

参考例8の化合物 553mg (0.608mmol)の塩化メチレン 5mL 溶液に、4 ージメチルアミノピリジン 111mg (0.911mmol)、ジフェニルクロロホスフェート 0.19mL (0.608mmol)を加え、室温で2時間攪拌した。この反応液を酢酸エチルで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル (3:1) で溶出すると、目的化合物 663mg (収率:96%) が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 3436, 2928, 2855, 1747 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 7. 36-7. 12 (m, 15H), 5. 87 (m, 1H), 5. 30-5. 21 (m, 3H,

139

PCT/JP01/03005

containing NH), 5.11, 5.06 (ABq, 2H, J=12.5 Hz), 4.89 (d, 1H, J=3.7 Hz), 4.79, 4.67 (ABq, 2H, J=12.5 Hz), 4.63 (q, 1H, J=9.5 Hz), 4.36 (dd, 1H, J=1.5, 11.7 Hz), 4.29 (dd, 1H, J=5.1, 11.7 Hz), 4.14 (dd, 1H, J=5.1, 13.2 Hz), 4.02-3.95 (m, 3H), 3.80 (m, 1H), 3.72-3.64 (m, 2H), 3.25 (t, 2H, J=6.6 Hz), 3.20 (m, 1H), 1.63-1.61 (m, 2H), 1.45-1.43 (m, 2H), 1.30-1.18 (m, 38H), 0.88 (t, 6H, J=6.6 Hz); MS (FAB, positive) m/z 1178 (M+K)⁺, 1162 (M+Na)⁺, 1140 (M+H)⁺;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{58}H_{86}Cl_3NO_{13}P$: 1140. 4902; Found: 1140. 4890. Anal. Calcd. for $C_{58}H_{85}Cl_3NO_{13}P$ (1141. 6): C, 61. 02; H, 7. 51; N, 1. 23; Cl, 9. 32; P, 2. 71. Found: C, 60. 49; H, 7. 61; N, 1. 19; Cl, 9. 44; P, 2. 96.

(参考例10)

WO 01/77133

6-O-ベンジルオキシカルボニル-2-デオキシ-4-O-ジフェニルホスホノ-3-O- { (R) -3-ドデシルオキシテトラデシル} -2- (2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ) -D-グルコピラノース

参考例9の化合物 613mg (0.537mmol)のテトラヒドロフラン 6mL 溶液に、(1,5 ーシクロオクタジエン)ビスー(メチルジフェニルホスフィン)ーイリジウム へキサフルオロホスフェート 31.5mg を加え、水素置換して赤色溶液が透明になったのち、窒素置換して室温で1時間攪拌した。その後、水 5mL、ヨウ素 276mg (1.09mmol)を加えて室温で30分間攪拌した。この溶液を酢酸エチルで希釈し、10%チオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(3:2)で溶出すると、目的化合物 421mg (収率:71%) が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 3600, 3435, 2928, 2855, 1747 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 7.34-7.12 (m, 15H), 5.43 (d, 1H, J=9.5 Hz, NH), 5.25 (t, 1H, J=3.7 Hz), 5.11, 5.06 (ABq, 2H, J=11.7 Hz), 4.76, 4.69 (ABq, 2H, J=12.1 Hz), 4.62 (q, 1H, J=9.5 Hz), 4.39-4.19 (m, 3H), 3.94 (m, 1H), 3.84-3.64 (m, 3H), 3.41 (brs, 1H, 0H), 3.27-3.20 (m, 3H, containing t, 2H, J=6.6 Hz, δ 3.25), 1.65-1.62 (m, 2H), 1.45-1.43 (m, 2H), 1.30-1.18 (m, 38H), 0.88 (t, 6H, J=6.6 Hz);

140

MS (FAB, positive) m/z 1138 $(M+K)^+$, 1122 $(M+Na)^+$, 1100 $(M+H)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z : Calcd. for $C_{55}H_{82}Cl_3NO_{13}P$: 1100. 4589; Found: 1100. 4601. Anal. Calcd. for $C_{55}H_{81}Cl_3NO_{13}P$ (1101. 6): C, 59. 97; H, 7. 41; N, 1. 27; Cl, 9. 66; P, 2. 81. Found: C, 58. 85; H, 7. 25; N, 1. 22; Cl, 9. 73; P, 2. 98.

(参考例11)

 $PJN = 6 - O - t e r t - \overline{J} + \overline{J$

参考例 7 の化合物 1.32g (1.70mmo1) の塩化メチレン 6mL 溶液に、tert-ブチル ジメチルシリルクロリド 385mg (2.56mmo1) と 4-ジメチルアミノピリジン 332mg (2.72mmo1) を加えて、室温で 3 時間攪拌した。この溶液を酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(9:1)で溶出すると、目的化合物 1.49g (収率:99%) が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 3438, 2928, 2856, 1742 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 5. 90 (m, 1H), 5. 31-5. 20 (m, 3H, containing NH), 4. 86 (d, 1H, J=3.7 Hz), 4. 79, 4. 70 (ABq, 2H, J=12.5 Hz), 4. 19 (dd, 1H, J=5.1, 12.5 Hz), 3. 98 (dd, 1H, J=6.6, 12.5 Hz), 3. 89-3. 76 (m, 5H), 3. 67-3. 36 (m, 7H, containing OH), 1. 72 (q, 2H, J=5.9 Hz), 1. 62-1. 21 (m, 40H), 0. 91-0. 86 (m, 15H), 0. 090 (s, 6H);

MS (FAB, positive) m/z 926 $(M+K)^+$, 888 $(M+H)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z : Calcd. for $C_{44}H_{84}Cl_3NO_8SiNa$: 910. 4930; Found: 910. 4911. Anal. Calcd. for $C_{44}H_{84}Cl_3NO_8Si$ (889. 6): C, 59. 41; H, 9. 52; N, 1. 58; Cl, 11. 96. Found: C, 59. 03; H, 9. 30; N, 1. 49; Cl, 12. 02.

(参考例12)

アリル 6-O-tert-ブチルジメチルシリル-4-O-ジフェニルホスホノ-2-デオキシ-3-O- $\{(R)-3-ドデシルオキシテトラデシル\}-2-(2,$

141

2, 2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ) $-\alpha-$ Dーグルコピラノシド

参考例 11 の化合物 1.45g(1.63mmol)について、参考例 9 と同様の操作を行うことにより、目的化合物 1.81g(収率:99%)が得られた。

IR v_{max} (CHCl₃) 3436, 2928, 2856, 1744 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDC1₃) δ 7. 35-7. 15 (m, 10H), 5. 92 (m, 1H), 5. 33-5. 23 (m, 3H, containing NH), 4. 90 (d, 1H, J=3. 7 Hz), 4. 81, 4. 69 (ABq, 2H, J=12. 1 Hz), 4. 55 (q, 1H, J=9. 5 Hz), 4. 22 (dd, 1H, J=5. 9, 13. 2 Hz), 4. 03-3. 86 (m, 2H), 3. 83-3. 65 (m, 6H), 3. 26-3. 19 (m, 3H), 1. 65-1. 18 (m, 42H), 0. 91-0. 85 (m, 15H), 0. 009 (s, 6H);

MS (FAB, positive) m/z 1158 $(M+K)^+$, 1142 $(M+Na)^+$, 1120 $(M+H)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{56}H_{94}Cl_3NO_{11}SiP$: 1120.5399; Found: 1120.5409. Anal. Calcd. for $C_{56}H_{93}Cl_3NO_{11}SiP$ (1121.8): C, 59.96; H, 8.36; N, 1.25; Cl, 9.48; P, 2.76. Found: C, 59.49; H, 8.23; N, 1.18; Cl, 9.66; P, 2.81.

(参考例13)

 $P J N 4 - O - \tilde{y} J x = N + X + V - 2 - \tilde{y} x + \tilde{y} - 3 - O - \{ (R) - 3 - \tilde{k} \}$ $\tilde{y} = \tilde{y} + \tilde{y$

参考例 12 の化合物 1.65g(1.47mmo1)のテトラヒドロフラン 9mL 溶液に 3 N塩酸水溶液 1.5mL を加えて、室温で 3 時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル (3:2)で溶出すると、目的化合物 1.31g(収率:89%)が得られた。

IR ν_{max} (KBr) 3499, 3373, 2921, 2851, 1713, 1646 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDC1₃) δ 7. 37-7. 18 (m, 10H), 5. 89 (m, 1H), 5. 33-5. 23 (m, 3H, containing NH), 4. 93 (d, 1H, J=3. 7 Hz), 4. 76, 4. 72 (ABq, 2H, J=12. 5 Hz), 4. 65 (q, 1H, J=9. 5 Hz), 4. 17 (dd, 1H, J=5. 9, 13. 2 Hz), 4. 03-3. 97 (m, 2H), 3. 88 (m, 1H), 3. 70-3. 59 (m, 5H), 3. 29-3. 21 (m, 3H), 1. 65 (q, 1H, J=6. 6 Hz), 1. 47-1. 18 (m, 40H), 0. 88 (t, 6H, J=6. 6 Hz);

142

MS (FAB, positive) m/z 1044 $(M+K)^+$, 1028 $(M+Na)^+$, 1006 $(M+H)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{50}H_{80}Cl_3NO_{11}P$: 1006. 4535; Found: 1006. 4539. Anal. Calcd. for $C_{50}H_{79}Cl_3NO_{11}P$ (1007. 5): C, 59.61; H, 7.90; N, 1.39; Cl, 10.56; P, 3.07. Found: C, 59.19; H, 7.82; N, 1.37; Cl, 10.66; P, 3.09.

(参考例14)

 \underline{r} リル $4-O-\overline{y}$ フェニルホスホノー $2-\overline{r}$ オキシー $3-O-\{(R)-3-\overline{r}\}$ \underline{r} シルオキシテトラデシル $\}$ $-6-O-\overline{y}$ チルー $2-(2,2,2-\overline{r})$ キシカルボニルアミノ) $-\alpha-D-\overline{y}$ ルコピラノシド

参考例 13 の化合物 385mg (0. 382mmo1) の塩化メチレン 5mL 溶液に、2,6ージー tertーブチルー4ーメチルピリジン 91mg (0. 441mmo1)、トリメチルオキソニウムテトラフルオロボレート 64mg (0. 435mmo1) を加えて、室温で20時間攪拌した。この反応液を酢酸エチルで希釈し、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(7:3)で溶出すると、目的化合物 357mg (収率:91%) が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 3436, 2928, 2855, 1744 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 7. 35-7. 15 (m, 10H), 5. 90 (m, 1H), 5. 33-5. 23 (m, 3H, containing NH), 4. 93 (d, 1H, J=3. 7 Hz), 4. 77, 4. 69 (ABq, 2H, J=11. 7 Hz), 4. 67 (m, 1H), 4. 21 (dd, 1H, J=5. 1, 13. 2 Hz), 4. 04-3. 98 (m, 2H), 3. 89-3. 65 (m, 4H), 3. 54 (dd, 1H, J=4. 4, 11. 0 Hz), 3. 48 (dd, 1H, J=2. 2, 11. 0 Hz), 3. 26-3. 19 (m, 6H, containing s, 3H, δ 3. 24), 1. 64-1. 62 (m, 2H), 1. 44-1. 43 (m, 2H), 1. 32-1. 17 (m, 38H), 0. 88 (t, 6H, J=6. 6 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 1058 $(M+K)^+$, 1042 $(M+Na)^+$, 1020 $(M+H)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{51}H_{82}Cl_3NO_{11}P$: 1020. 4691; Found: 1020. 4669. Anal. Calcd. for $C_{51}H_{81}Cl_3NO_{11}P$ (1021. 5): C, 59. 97; H, 7. 99; N, 1. 37; Cl, 10. 41; P, 3. 03. Found: C, 59. 10; H, 7. 85; N, 1. 29; Cl, 10. 51; P, 3. 27.

(参考例15)

PCT/JP01/03005

参考例 14 の化合物 695mg (0.681mmo1) について、参考例 10 と同様の操作を行うことにより、目的化合物 483mg (収率:72%) が得られた。

IR ν_{max} (KBr) 3426, 3339, 2922, 2851, 1721 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 7. 35-7. 16 (m, 10H), 5. 40 (d, 1H, J=9.5 Hz, NH), 5. 27 (t, 1H, J=3.7 Hz), 4. 75, 4. 70 (ABq, 2H, J=11.7 Hz), 4. 55 (q, 1H, J=9.5 Hz), 4. 13 (m, 1H), 3. 95 (m, 1H), 3. 85-3. 65 (m, 4H, containing 0H), 3. 51-3. 43 (m, 2H), 3. 26-3. 16 (m, 6H, containing t, 2H, J=6.6 Hz, δ 3. 25, s, 3H, δ 3. 21), 1. 65-1. 64 (m, 2H), 1. 44-1. 42 (m, 2H), 1. 32-1. 17 (m, 38H), 0. 88 (t, 6H, J=6.6 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 1018 $(M+K)^+$, 1002 $(M+Na)^+$, 980 $(M+H)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{48}H_{78}Cl_3NO_{11}P$: 980. 4360; Found: 980. 4378. Anal. Calcd. for $C_{48}H_{77}Cl_3NO_{11}P$ (981. 5): C, 58. 74; H, 7. 91; N, 1. 43; Cl, 10. 84; P, 3. 16. Found: C, 58. 49; H, 8. 15; N, 1. 51; Cl, 10. 74; P, 3. 24.

(参考例16) ·

WO 01/77133

Tリル 2, 6 -ジデオキシー4-O-ジフェニルホスホノ-3-O-{(R) -3-ドデシルオキシテトラデシル}-6-フルオロ-2-(2, 2, 2<math>-トリクロロエトキシカルボニルアミノ)- α -D-グルコピラノシド

参考例 13 の化合物 521mg (0.517mmo1) の 1, 2-iジメトキシエタン 5mL 溶液に、窒素雰囲気下、-40 $^{\circ}$ でジエチルアミノサルファートリフルオリド (DAST) 0. 2mL (1.51mmo1) を加えて 3 0 分間攪拌した後、0 $^{\circ}$ で 2 時間攪拌した。水を加えて反応を止め、酢酸エチルで抽出し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、中性シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル (3:1) で溶出すると、目的化合物 432mg (収率:83%) が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 3691, 3436, 2928, 2855, 1744 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDC1₃) δ 7.34-7.16 (m, 10H), 5.89 (m, 1H), 5.34-5.24 (m, 3H,

144

containing NH), 4. 94 (d, 1H, J=3.7 Hz), 4. 79, 4. 68 (ABq, 2H, J=11.7 Hz), 4. 64-4. 55 (m, 2H), 4. 46 (m, 1H), 4. 20 (dd, 1H, J=5.9, 13.2 Hz), 4. 05-3. 90 (m, 3H), 3. 83-3. 65 (m, 3H), 3. 25 (t, 2H, J=6.6-7.3 Hz), 3. 21 (m, 1H), 1. 65-1. 57 (m, 2H), 1. 45-1. 43 (m, 2H), 1. 32-1. 17 (m, 38H), 0. 88 (t, 6H, J=6.6-7.3 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 1046 $(M+K)^+$, 1030 $(M+Na)^+$, 1008 $(M+H)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{50}H_{79}Cl_3FNO_{10}P$: 1008. 4491; Found: 1008. 4485. Anal. Calcd. for $C_{50}H_{78}Cl_3FNO_{10}P$ (1009. 5): C, 59. 49; H, 7. 79; N, 1. 39; Cl, 10. 54; F, 1. 88; P, 3. 07. Found: C, 59. 45; H, 7. 68; N, 1. 48; Cl, 10. 45; F, 2. 25; P, 3. 24.

(参考例17)

2, $6-\tilde{y}$ デオキシー $4-O-\tilde{y}$ フェニルホスホノー $3-O-\{(R)-3-\tilde{r}$ デシルオキシテトラデシル $\}$ -6-フルオロー2-(2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ $\}$ -D-グルコピラノース

参考例 16 の化合物 416mg (0.412mmo1) について、参考例 10 と同様の操作を行うことにより、目的化合物 329mg (収率:82%) が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 3602, 3435, 2928, 2855, 1745 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 7. 35-7. 17 (m, 10H), 5. 47 (d, 1H, J=9.5 Hz, NH), 5. 31 (t, 1H, J=3.7 Hz), 4. 76, 4. 71 (ABq, 2H, J=11.7 Hz), 4. 60 (q, 1H, J=9.5 Hz), 4. 56 (m, 1H), 4. 44 (m, 1H), 4. 17 (m, 1H), 3. 96 (m, 1H), 3. 85-3. 65 (m, 4H, containing OH), 3. 27-3. 21 (m, 3H, containing t, 2H, J=6.6 Hz, δ 3. 26), 1. 67-1. 62 (m, 2H), 1. 45-1. 44 (m, 2H), 1. 32-1. 18 (m, 38H), 0. 88 (t, 6H, J=6.6 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 1006 (M+K)⁺, 990 (M+Na)⁺, 968 (M+H)⁺;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{47}H_{75}Cl_3FNO_{10}P$: 968. 4187; Found: 968. 4178. Anal. Calcd. for $C_{47}H_{74}Cl_3FNO_{10}P$ (969. 4): C, 58. 23; H, 7. 69; N, 1. 45; Cl, 10. 97; F, 1. 96; P, 3. 20. Found: C, 58. 27; H, 7. 76; N, 1. 43; Cl, 11. 20; F, 2. 04; P, 3. 25.

(参考例18)

参考例 10 の化合物 352mg (0. 320mmo1) の塩化メチレン 5mL 溶液に、トリクロロアセトニトリル 0. 32mL(3. 20mmo1)、炭酸セシウム 53mg (0. 163mmo1) を加えて、室温で1時間攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 10mL を加えて反応を止め、この反応混合物を塩化メチレンで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、真空ポンプで乾燥すると、1位トリクロロアセトイミデート体 399mg (定量的) が得られた。

得られたイミデート体と、実施例 4のジオール体を塩化メチレン 5mL に溶解し、モレキュラーシーブス 4 Aを 420mg 加えて、室温で 1 時間攪拌し、反応系の水分を除去した。その後、この溶液を-4 O $^{\circ}$ に冷却し、トリメチルシリルトリフルオロメタンスルホネート 6μ L (0.033mmo 1) を加えて、1 時間攪拌した。反応終了後、モレキュラーシーブス 4 Aを濾別し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル (3:2) で溶出すると、目的化合物 471mg (収率:77%)が得られた。

IR v_{max} (CHCl₃) 3442, 2928, 2855, 1748, 1667 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CDC1₃) δ 7. 34-7. 11 (m, 35H), 6. 89 (s, 1H), 6. 75 (d, 1H, J=9. 5 Hz, NH), 5. 52 (m, 1H), 5. 09, 5. 04 (ABq, 2H, J=12. 5 Hz), 4. 86 (m, 1H), 4. 74-4. 67 (m, 3H), 4. 56-4. 36 (m, 6H, containing d, 1H, J=3. 7 Hz, δ 4. 43), 4. 23 (dd, 1H, J=5. 1, 12. 5 Hz), 4. 17 (td, 1H, J=10. 3, 3. 7 Hz), 4. 04 (s, 2H), 3. 96-3. 89 (m, 2H), 3. 82 (m, 1H), 3. 76-3. 57 (m, 7H), 3. 45-3. 41 (m, 2H), 3. 33 (t, 1H, J=9. 5 Hz), 3. 27-3. 20 (m, 4H), 3. 08 (brs, 1H, OH), 2. 38-2. 36 (m, 2H), 1. 77-1. 25 (m, 84H), 0. 88 (t, 12H, J=6.6 Hz);

146

MS (FAB, positive) m/z 2141 $(M+K)^+$, 2125 $(M+Na)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{118}H_{170}Cl_3N_2O_{22}PK$: 2142.0686; Found: 2142.0625. Anal. Calcd. for $C_{118}H_{170}Cl_3N_2O_{22}P$ (2105.9): C, 67.30; H, 8.14; N, 1.33; Cl, 5.05; P, 1.47. Found: C, 67.10; H, 7.95; N, 1.31; Cl, 5.02; P, 1.53.

(参考例19)

 $\frac{\dot{y}}{2}$ $\frac{\dot$

参考例 15 の化合物 410.3mg (0.418mmo1) について、参考例 18 と同様の操作を行うことにより、目的化合物 537mg (収率:71%) が得られた。

IR v_{max} (CHCl₃) 3441, 2928, 2855, 1747, 1667 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDC1₃) δ 7.36-7.15 (m, 30H), 6.90 (s, 1H), 6.74 (d, 1H, J=9.5 Hz, NH), 5.45 (m, 1H), 4.84 (m, 1H), 4.74-4.71 (m, 3H), 4.55 (q, 1H, J=9.5 Hz), 4.48-4.38 (m, 4H), 4.17 (td, 1H, J=10.3, 3.7 Hz), 4.04 (s, 2H), 3.97-3.46 (m, 14H), 3.34 (t, 1H, J=9.5 Hz), 3.29-3.12 (m, 8H, containing s, 3H, δ 3.20), 2.37-2.36 (m, 2H), 1.78-1.25 (m, 84H), 0.88 (t, 12H, J=6.6 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 2021 $(M+K)^+$, 2005 $(M+Na)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z : Calcd. for $C_{111}H_{166}Cl_3N_2O_{20}PNa$: 2006. 0735; Found: 2006. 0745. Anal. Calcd. for $C_{111}H_{166}Cl_3N_2O_{20}P$ (1985. 84): C, 67. 14; H, 8. 43; N, 1. 41; Cl, 5. 36; P, 1. 56. Found: C, 67. 19; H, 8. 11; N, 1. 68; Cl, 5. 59; P, 1. 68.

(参考例20)

ジフェニルメチルオキシカルボニルメチル $2-\{(R)-3-ベンジルオキシテトラデカナミド\}-3-O-\{(R)-3-ベンジルオキシテトラデシル\}-2-デオキシ-6-O-[2,6-ジデオキシ-4-O-ジフェニルホスホノ-3-O-$

参考例 17 の化合物 420mg (0.433mmo1) について、参考例 18 と同様の操作を行うことにより、目的化合物 570mg (収率:73%) が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 3443, 3358, 2928, 2855, 1745, 1667 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 7. 35-7. 17 (m, 30H), 6. 90 (s, 1H), 6. 77 (d, 1H, J=9. 5 Hz, NH), 5. 54 (m, 1H), 4. 90 (m, 1H), 4. 73-4. 71 (m, 3H), 4. 59-4. 37 (m, 7H), 4. 17 (td, 1H, J=10. 3, 3. 7 Hz), 4. 05 (s, 2H), 4. 05-3. 90 (m, 2H), 3. 82 (m, 1H), 3. 75-3. 48 (m, 8H), 3. 43 (t, 1H, J=9. 5 Hz), 3. 34 (t, 1H, J=9. 5 Hz), 3. 27-3. 21 (m, 5H), 2. 38-2. 33 (m, 2H), 1. 77-1. 25 (m, 84H), 0. 88 (t, 12H, J=6. 6 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 2009 $(M+K)^+$, 1993 $(M+Na)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z : Calcd. for $C_{110}H_{163}Cl_3FN_2O_{19}PNa$: 1994. 0535; Found: 1994. 0587. Anal. Calcd. for $C_{110}H_{163}Cl_3FN_2O_{19}P$ (1973. 8): C, 66. 94; H, 8. 32; N, 1. 42; Cl, 5. 39; P, 1. 57. Found: C, 67. 03; H, 8. 24; N, 1. 43; Cl, 5. 36; P, 1. 65.

(参考例21)

参考例 18 の化合物 271mg (0.128mmo1)の酢酸 3mL 溶液に、酸処理した亜鉛 168mg (2.57mmo1)を加えて、室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を濾過し、酢酸エチルで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、真空ポンプで乾燥すると、アミン 250mg が得られた。このアミンをテトラヒドロフラン 2mL、水 2mL に溶解し、ピリジン $52 \mu 1$ 、無水酢酸 $60 \mu 1$ を加えて室温で 1 時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩

水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーのにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(1:1)で溶出すると、目的化合物 212mg(収率:84%)が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 3450, 2928, 2855, 1751, 1668 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 7.34-7.11 (m, 35H), 6.89 (s, 1H), 6.72 (d, 1H, J=9.5 Hz, NH), 6.16 (d, 1H, J=6.6 Hz, NH), 5.22 (d, 1H, J=8.1 Hz), 5.09, 5.04 (ABq, 2H, J=12.1 Hz), 4.73 (d, 1H, J=3.7 Hz), 4.51-4.36 (m, 6H), 4.23-4.15 (m, 2H), 4.06-4.02 (m, 3H, containing s, 2H, δ 4.02), 3.94 (m, 1H), 3.83 (m, 1H), 3.73-3.62 (m, 7H), 3.48-3.46 (m, 3H, containing 0H), 3.36-3.24 (m, 4H), 3.08 (m, 1H), 2.36 (d, 2H, J=6.6 Hz), 1.95 (s, 3H), 1.75-1.20 (m, 84H), 0.88 (t, 12H, J=6.6 Hz); MS (FAB, positive) m/z 2009 (M+K)⁺, 1993 (M+Na)⁺;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z : Calcd. for $C_{117}H_{171}N_2O_{21}PNa$: 1994. 2010; Found: 1994. 2020. Anal. Calcd. for $C_{117}H_{171}N_2O_{21}P$ (1972. 6): C, 71. 24; H, 8. 74; N, 1. 42; P, 1. 57. Found: C, 71. 70; H, 8. 69; N, 1. 39; P, 1. 56.

(参考例22)

参考例 19 の化合物 340mg (0.171mmo1) について、参考例 21 と同様の操作を行うことにより、目的化合物 280mg (収率:88%) が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 3692, 3451, 3363, 2928, 2855, 1755, 1668 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 7.36-7.16 (m, 30H), 6.89 (s, 1H), 6.73 (d, 1H, J=9.5 Hz, NH), 6.09 (d, 1H, J=6.6 Hz, NH), 5.16 (d, 1H, J=8.1 Hz), 4.73 (d, 1H, J=3.7 Hz), 4.51 (q, 1H, J=9.5 Hz), 4.45-4.38 (m, 4H), 4.18 (dt, 1H, J=10.3, 3.7 Hz), 4.05-3.96 (m, 4H, containing s, 2H, δ 4.02), 3.83 (m, 1H), 3.77-3.46 (m, 11H, containing OH), 3.37-3.22 (m, 5H), 3.20-3.14 (m, 4H, containing s, 3H, δ 3.20),

149

2. 36 (d, 2H, J=5.9 Hz), 1. 96 (s, 3H), 1. 76-1. 20 (m, 84H), 0. 88 (t, 12H, J=6.6 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 1889 $(M+K)^+$, 1873 $(M+Na)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: Calcd. for $C_{110}H_{167}N_2O_{19}PNa$: 1874.1798; Found: 1874.1810. Anal. Calcd. for $C_{110}H_{167}N_2O_{19}P$ (1852.5): C, 71.32; H, 9.09; N, 1.51; P, 1.67. Found: C, 71.68; H, 9.18; N, 1.54; P, 1.72.

(参考例23)

ジフェニルメチルオキシカルボニルメチル 6-O-[2-Pセタミド-2, 6-V)ジデオキシー4-O-ジフェニルホスホノー $3-O-\{(R)-3-V$ デシルオキシテトラデシル-6-フルオロー $\beta-D-$ グルコピラノシル $-2-\{(R)-3-V$ グンジルオキシテトラデカナミド $-3-O-\{(R)-3-V$ グンジルオキシテトラデカナミド $-3-O-\{(R)-3-V$ グンシャプシャ-2-デオキシー $\alpha-D-$ グルコピラノシド

参考例 20 の化合物 339mg (0.172mmo1) について、参考例 21 と同様の操作を行うことにより、目的化合物 279mg (収率:88%) が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 3692, 3451, 3360, 2928, 2855, 1754, 1669 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CDC1₃) δ 7. 34-7. 17 (m, 30H), 6. 89 (s, 1H), 6. 75 (d, 1H, J=9. 5 Hz, NH), 6. 18 (d, 1H, J=5. 9 Hz, NH), 4. 73 (d, 1H, J=3. 7 Hz), 4. 58-4. 38 (m, 7H), 4. 18 (dt, 1H, J=10. 3, 3. 7 Hz), 4. 10 (t, 1H, J=9. 5, 10. 3 Hz), 4. 02 (d, 2H, J=4. 4 Hz), 3. 97 (m, 1H), 3. 83 (m, 1H), 3. 72-3. 61 (m, 6H), 3. 50-3. 48 (m, 3H, containing OH), 3. 37-3. 26 (m, 5H), 3. 08 (m, 1H), 2. 37-2. 36 (m, 2H), 1. 95 (s, 3H), 1. 77-1. 20 (m, 84H), 0. 88 (t, 12H, J=6. 6 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 1877 $(M+K)^+$, 1862 $(M+Na)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z : Calcd. for $C_{109}H_{164}N_2O_{18}FPNa$: 1862.1599; Found: 1862.1622. Anal. Calcd. for $C_{109}H_{164}N_2O_{18}FP$ (1840.4): C, 71.13; H, 8.98; N, 1.52; F; 1.03; P, 1.68. Found: C, 71.41; H, 9.01; N, 1.50; F, 1.08; P, 1.77.

(参考例24)

<u>カルボキシメチル 6-O-[2-アセタミド-2-デオキシー4-O-ジフェニ</u>

ルホスホノ $-3-O-\{(R)-3-$ ドデシルオキシテトラデシル $\}-\beta-$ D-グル コピラノシル]-2-デオキシ $-2-\{(R)-3-$ ヒドロキシテトラデカナミド $\}-3-$ O $-\{(R)-3-$ ヒドロキシテトラデシル $\}-\alpha-$ D-グルコピラノシド

参考例 21 の化合物 159mg (0.081mmo1)のエタノール 5mL 溶液に、20%水酸化パラジウムー炭素を加えて、水素雰囲気下で室温にて18時間攪拌した。反応終了後、この反応混合物を濾過し、減圧下濃縮して、薄層シリカゲルクロマトグラフィー(展開溶媒;クロロホルムーメタノール(4:1))にて精製した。溶出したものにクロロホルム 10mL を加えて、0.05 N塩酸水溶液で洗浄して混入するシリカゲルを除去し、減圧下でクロロホルムを留去すると目的化合物 65.4mg (収率:55%)が得られた。

IR $\nu_{\rm max}$ (CD₃OD) 3430 (broad), 3326 (broad), 2927, 2855, 1729, 1653 cm⁻¹; 1 H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 7. 40-7. 19 (m, 10H), 4. 78 (d, 1H, J=3. 7 Hz), 4. 59 (d, 1H, J=7.3 Hz), 4. 54 (m, 1H), 4. 23, 4. 10 (ABq, 2H, J=16. 8 Hz), 4. 12 (m, 1H), 4. 03-4. 00 (m, 2H), 3. 91 (m, 1H), 3. 80-3. 52 (m, 11H), 3. 42-3. 26 (m, 5H), 2. 41-2. 36 (m, 2H), 2. 00 (s, 3H), 1. 73-1. 29 (m, 84H), 0. 90 (t, 12H, J=6.6 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 1529 $(M+K)^+$, 1513 $(M+Na)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z : Calcd. for $C_{82}H_{143}N_2O_{19}PNa$: 1513.9920; Found: 1513.9908.

(参考例25)

 $\frac{D}{D}$ $\frac{D$

参考例 22 の化合物 231mg (0.125mmo1) について、参考例 24 と同様の操作を行うことにより、目的化合物 143mg (収率:76%) が得られた。

IR ν_{max} (KBr) 3308, 3073, 2924, 2854, 1730, 1657 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CD₃0D) δ 7.72 (m, 1H, NH), 7.62 (m, 1H, NH), 7.41-7.20 (m, 10H), 4.73 (d, 1H, J=2.9 Hz), 4.63 (d, 1H, J=8.1 Hz), 4.55 (q, 1H, J=8.8 Hz),

4. 21 (m, 1H), 4. 17, 4. 05 (ABq, 2H, J=16. 8 Hz), 4. 05-3. 96 (m, 2H), 3. 93-3. 63 (m, 8H), 3. 56 (t, 1H, J=10. 3, 8. 8 Hz), 3. 48 (m, 2H), 3. 38 (t, 1H, J=9. 5 Hz), 3. 34-3. 22 (m, 5H), 3. 21 (s, 3H), 2. 43-2. 33 (m, 2H), 2. 01 (s, 3H), 1. 70-1. 21 (m, 84H), 0. 90 (t, 12H, J=6. 6 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 1543 $(M+K)^+$, 1527 $(M+Na)^+$;

High Resolution MS (FAB, positive) m/z : Calcd. for $C_{83}H_{145}N_2O_{19}PNa$: 1528.0077; Found: 1528.0076. Anal. Calcd. for $C_{83}H_{145}N_2O_{19}P$ (1506.0): C, 66.19; H, 9.71; N, 1.86; P, 2.06. Found: C, 65.56; H, 9.86; N, 1.58; P, 2.00.

(参考例26)

カルボキシメチル $6-O-[2-Pセタミド-2、6-ジデオキシ-4-O-ジ フェニルホスホノ-3-O-{(R)-3-ドデシルオキシテトラデシル}-6-フ ルオロ-<math>\beta$ -D-グルコピラノシル]-2-デオキシ-2-{(R)-3-ヒドロキシテトラデカナミド}-3-O-{(R)-3-ヒドロキシテトラデシル}- α -D-グルコピラノシド

参考例 23 の化合物 236mg (0.128mmo1) について、参考例 24 と同様の操作を行うことにより、目的化合物 125mg (収率:66%) が得られた。

IR ν_{max} (KBr) 3305 (broad), 3074, 2924, 2854, 1731, 1646 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CD₃0D) δ 7.71 (m, 1H, NH), 7.62 (m, 1H, NH), 7.39-7.18 (m, 10H), 4.78 (d, 1H, J=2.9 Hz), 4.64 (d, 1H, J=8.1 Hz), 4.56-4.36 (m, 3H), 4.27-4.09 (m, 4H, containing ABq, 2H, J=16.8 Hz, δ 4.25, 4.10), 4.04-4.00 (m, 2H), 3.90 (m, 1H), 3.82-3.65 (m, 8H), 3.54 (t, 1H, J=11.0-8.8 Hz), 3.39-3.27 (m, 4H), 2.42-2.33 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.70-1.29 (m, 84H), 0.89 (t, 12H, J=6.6 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 1531 (M+K), 1515 (M+Na);

High Resolution MS (FAB, positive) m/z : Calcd. for $C_{82}H_{142}N_2O_{18}FPNa$: 1515. 9877; Found: 1515. 9871. Anal. Calcd. for $C_{82}H_{142}N_2O_{18}FP$ (1494. 0): C, 65. 92; H, 9. 58; N, 1. 88; F; 1. 27; P, 2. 07. Found: C, 66. 09; H, 9. 60; N, 1. 59; F, 1. 27; P, 1. 96.

(参考例27)

原料のアリル 2ーデオキシー4,6ー〇ーイソプロピリデンー2ー(2,2,2ートリクロロエトキシカルボニルアミノ)ー α ーDーグルコピラノシド 3.00 g (6.90mmo1)のメチレンクロライド 30mL 溶液に、1,3ージシクロヘキシルカルボジイミド 2.14g (10.4mmo1)、ジメチルアミノピリジン 2.14g (10.4mmo1)、(R)ー3ー(ドデカノイルオキシ)テトラデカン酸 3.53g(8.28mmo1)を加え、室温で18時間攪拌した。この溶液を濾過し、酢酸エチルで希釈して、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(9:1)で溶出すると、目的化合物 5.90g (収率99%) が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 1649, 1743, 3333 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 0.88 (m, 6H), 1.25-1.64 (m, 44H, including 3H, s, at 1.38ppm and 3H, s, at 1.49 ppm), 2.25-2.29 (m, 2H), 2.49 (dd, 1H, J=6.4Hz, 15,4Hz), 2.64 (dd, 1H, J=6,4Hz, 15.4Hz), 3.70-3.79 (m, 3H), 3.87-3.89 (m, 1H), 3,94-4.13 (m, 2H), 4.16-4.21 (m, 1H), 4.71 (dd, 2H, J=12.0Hz, 22.4Hz), 4.89 (d, 1H, J=3.7Hz), 5.12-5.39 (m, 5H), 5.83-5.93 (m, 1H);

High Resolution MS (FAB, positive) : Calcd. for $C_{41}H_{71}NO_{10}Cl_3$ (M+H) $^+$:842.4144, Found:842.4155.

(参考例28)

参考例 27 の化合物 5.70g(6.75mmo1)をメタノール 20mL、テトラヒドフラン 5mL に溶解し、カンファースルホン酸 0.157g(0.675mmo1)を加え、室温で3時間攪拌した。トリエチルアミンを加えて反応を止め、溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(7:3)で溶出すると、目的化

合物 3.15g(収率:58%)が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 1700, 1721, 1735, 2852, 2922, 3392 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 0.88 (t, 6H, J=6, 7-7.3Hz), 1.26-1.68 (m, 40H), 2.28-2.32 (m, 2H), 2.51-2.58 (m, 2H), 3.69-3.78 (m, 2H), 3.88-4.03 (m, 4H), 4.21 (m, 1H), 4.71 (dd, 2H, J=12.0Hz, 35.2Hz), 4.92 (d, 1H, J=3.3Hz), 5.12-5.17 (m, 2H), 5.22-5.33 (m, 2H), 5.46 (d, 1H, J=9.8Hz), 5.87-5.93 (m, 1H);

Anal. Calcd. for $C_{38}H_{66}NO_{10}Cl_3$ (803. 302): C, 56. 82; H, 8. 28; N, 1. 74; Cl, 13. 24; Found: C, 56. 60; H, 7. 95; N, 1. 89; Cl, 13. 69.

High Resolution MS (FAB, positive) : Calcd. for $C_{38}H_{66}NO_{10}Cl_3Na$ (M+Na)⁺: 824. 3650, Found: 824. 3615.

(参考例29)

アリル 6-O-t e r t - ブチルジメチルシリル-2-デオキシ-3-O- { (R) -3-ドデカノイルオキシテトラデカノイル} -2- (2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ) $-\alpha-D-$ グルコピラノシド

参考例 28 の化合物 2.50g(3.11mmo1)について参考例 11 と同様の操作を行うことにより目的化合物 2.68g(収率:94%)が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 1517, 1743, 3339 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDC1₃) δ 5. 92-5. 85 (m, 1H), 5. 42 (d, 1H, J=9. 6Hz), 5. 32-5. 13 (m, 4H), 4. 90 (d, 1H, J=3. 6Hz), 4. 71 (d, 1H, J=12. 0Hz, 25. 5Hz), 4. 22-4. 11 (m, 1H), 4. 02-3. 97 (m, 1H), 3. 94-3. 87 (m, 3H), 3. 72-3. 68 (m, 2H), 3. 39 (br, 1H), 2. 62-2. 49 (m, 2H), 2. 30-2. 27 (m, 2H), 1. 71-1. 26 (m, 38H), 0. 98-0. 87 (m, 15H), 0. 10 (m, 6H);

Anal. Calcd. for $C_{44}H_{80}NO_{10}Cl_3Si$ (917. 566) C, 57. 60; H, 8.79; N, 1.53; C1, 11.59; Found: C, 60.44; H, 9.16; N, 1.55; C1, 12.66.

High Resolution MS (FAB, positive) : Calcd. for: $C_{44}H_{80}NO_{10}Cl_3SiK$ (M+K)⁺: 954.4254, Found: 954.4242.

(参考例30)

アリル $2-デオキシ-4-O-ジフェニルホスホノ-3-O-\{(R)-3-ドラブカノイルオキシテトラデカノイル <math>-2-(2,2,2-F)$ ボニルアミノ) $-\alpha-D-$ グルコピラノシド

参考例 29 の化合物 2.68g (2.92mmo1)のメチレンクロライド 10mL 溶液に、ジメチルアミノピリジン 713mg (5.84mmo1)、ジフェニルクロロホスフェート 713mg (5.84mmo1)を加え、室温で16時間攪拌した。この反応液を酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥し、混合物を得た。

この混合物を、THF 10mL に溶かし、3M HC la. q. を加え、50℃で1時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルクロマトグラフィにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル (1:1) で溶出すると、目的化合物 2.67g(収率:88%)が得られた。

IR v_{max} (CHCl₃) 1516, 1591, 1744, 3335, 3439 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 0.88 (m, 6H), 1.07-1.78 (m, 38H), 2.16-2.20 (m, 2H), 2.40-2.46 (m, 2H), 3.63-3.67 (m, 2H), 3.76 (d, 1H, J=9.8Hz), 3.98-4.08 (m, 2H), 4.16-4.21 (m, 1H), 4.62-4.81 (m, 3H), 4.97 (d, 1H, J=3.6Hz), 5.10-5.16 (m, 1H), 5.23-5.33 (m, 2H), 5.41-5.49 (m, 2H), 5.83-5.92 (m, 1H), 7.16-7.38 (m, 10H); Anal. Calcd. for $C_{50}H_{75}NO_{13}Cl_3P$ (1035.477): C, 58.00; H, 7.30; N, 1.35; C1, 10.27; Found: C, 58.28; H, 7.30; N, 1.35; C1, 10.34

High Resolution MS (FAB, positive) : Calcd. for $C_{50}H_{75}NO_{13}Cl_3PK$ (M+K)⁺: 1072. 3679, Found: 1072. 3677.

(参考例31)

Tリル 2, 6-ジデオキシー4-O-ジフェニルホスホノー3-O-{(R) -3-ドデカノイルオキシテトラデカノイル} -6-フルオロー2-(2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ) $-\alpha$ -D-グルコピラノシド

参考例30の化合物 129mg(0.124mmo1)について参考例16と同様の操作を行うことにより、目的化合物 83mg(収率:67%)を得た。

IR ν_{max} (CHCl₃) 1592, 1746, 3425, cm⁻¹;

¹H-NMR (500MHz, CDCl₃) δ 0.88 (t, 6H, J=6.6Hz), 1.21-1.63 (m, 40H), 2.14 (t, 2H, J=7.3Hz), 2.45 (d, 2H, J=6.6Hz), 3.93-4.06 (m, 3H), 4.21 (dd, 1H, J=5.4Hz,

155

PCT/JP01/03005

13. 1Hz), 4. 46 (d, 1H, J=37. 9Hz), 4. 60-4. 81 (m, 2H), 4. 98 (d, 1H, J=3. 7Hz), 5. 08-5. 15 (m, 1H), 5. 24-5. 34 (m, 2H), 5. 42-5. 49 (m, 2H), 5. 83-5. 93 (m, 1H), 7. 16-7. 36 (m, 10H);

Anal. Calcd. for $C_{50}H_{74}Cl_3FNO_{12}P$ (1037. 468): C, 57. 89; H, 7. 19; N, 1. 35; F, 1. 83; P, 2. 99; Cl, 10. 25; Found: C, 56. 97; H, 7. 01; N, 1. 31; F, 2. 39; P, 2. 99; Cl, 11. 02. High Resolution MS (FAB, positive): Calcd. for $C_{50}H_{75}NO_{12}Cl_3FP$ (M+H) $^+$: 1036. 4077, Found: 1036. 4076.

(参考例32)

WO 01/77133

2, $6-\tilde{y}$ デオキシー $4-O-\tilde{y}$ フェニルホスホノー $3-O-\{(R)-3-\tilde{r}\}$ カノイルオキシテトラデカノイル $\}-6-$ フルオロー2-(2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ $)-\alpha-$ D-グルコピラノース

参考例31の化合物 85.8mg(0.083mmo1)について参考例10と同様の操作を行うことにより、目的化合物 59.1mg(収率:71%)を得た。

IR ν_{max} (CHCl₃) 1592, 1728, 1740, 3431 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 0.88 (t, 6H, J=6.6Hz), 1.25-1.81 (m, 40H), 2.15-2.19 (m, 2H), 2.36-2.48 (m, 2H), 4.00-4.05 (m, 1H), 4.22 (dd, 1H, J=10.3Hz, 26.3Hz), 4.45 (d, 2H, J=46.9Hz), 4.67-4.76 (m, 4H), 5.06-5.13 (m, 1H), 5.38 (t, 1H, J=3.67Hz), 5.53 (t, 1H, J=9.8Hz), 5.91 (1H, d, J=9.5Hz), 7.16-7.36 (m, 10H); Anal. Calcd. for $C_{47}H_{70}Cl_3FNO_{12}P$ (997.403); C, 56.60; H, 7.07; N, 1.40; F, 1.91; P, 3.11; Cl, 10.66; Found; C, 55.48; H, 6.79; N, 1.35; F, 1.49; P, 2.99; Cl, 9.97. High Resolution MS (FAB, positive): Calcd. for $C_{47}H_{71}Cl_3FNO_{12}P$ (M+H)⁺: 996.3764, Found: 996.3782.

(参考例33)

原料のアリル 2-アミノー2-デオキシー4.6-O-イソプロピリデンー α -

Dーグルコピラノシド 100 mg (0. 363 mmo1) のメチレンクロライド 1mL 溶液に室温で、4-ジメチルアミノピリジン 133 mg (1. 09 mmo1)、(R) -3-ベンジルオキシテトラデカン酸 267 mg (0. 799 mmo1)、ジシクロヘキシルカルボニル 225 mg (1. 09 mmo1) を加え 16 mmo1 6 時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈した後、0. 1N 塩酸水溶液で中和し、飽和炭酸水ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、シリカゲルクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン一酢酸エチル (7:3) で溶出すると、目的化合物 247 mg (収率:76%) が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 1658, 1740, 3331 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 0.88 (6H, t, J=6.7Hz), 1.24-1.67 (46H, m), 2.29-2.43 (3H, m), 2.65-2.71 (1H, m), 3.73-3.85 (7H, m), 3.93-4.03 (2H, m), 4.31-4.37 (1H, m), 4.44-4.59 (4H, m), 4.74 (1H, d, J=3.7Hz), 5.04-5.21 (3H, m), 5.69-5.73 (1H, m), 6.29 (1H, d, J=9.5Hz), 7.09-7.35 (10H, m);

Anal. Calcd. for $C_{55}H_{89}NO_9$ (907. 6537): C, 72. 73; H, 9. 88; N, 1. 54; Found: C, 73. 03; H, 9. 16; N, 1. 83.

(参考例34)

 $\frac{\dot{y}}{2}$ $\frac{$

参考例33の化合物 226mg(0.253mmo1)について参考例3と同様の操作を行うことにより、目的化合物 139mg(収率53%)が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 1602, 1671, 1744 cm⁻¹;

¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 0.88 (t, 6H, J=6.5-7.0Hz), 1.15-1.84 (m, 40H), 2.35-2.71 (m, 4H), 3.68-3.90 (m, 6H), 3.92-4.03 (m, 3H), 4.40-4.57 (m, 4H), 4.58 (d, 1H, J=11.5Hz), 4.73 (d, 1H, J=3.6Hz), 5.20-5.25 (m, 1H), 6.72 (d, 1H, J=9.4Hz), 6.89 (s, 1H), 7.17-7.65 (m, 20H);

Anal. Calcd. for $C_{66}H_{93}NO_{11}$ (1076. 466): C, 73.64; H, 8.71; N, 1.30; Found: C, 72.92; H, 8.25; N, 1.25.

High Resolution MS (FAB, positive): Calcd. for: $C_{66}H_{94}NO_{11}(M+H)^{+}$; 1076.6827,

157

Found 1076. 6825.

(参考例35)

参考例34の化合物 142mg(0.132mmo1)について参考例28と同様の操作を行うことにより、目的化合物108mg(収率:79%)が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 1601, 1671, 1743, 3431 cm⁻¹;

 1 H-NMR (500MHz, CDC1₃) δ 0.88 (6H, t, J=6.9Hz), 1.25–1.80 (m, 40H), 2.36 (d, 2H, J=5.7Hz), 2.46 (dd, 1H, J=4.5Hz, 14.7Hz), 2.60 (dd, 1H, J=8.2Hz, 14.7Hz), 3.62 (t, 1H, J=9.2Hz), 3.69–3.72 (m, 3H), 3.78–3.82 (m, 1H), 3.85–3.90 (m, 1H), 3.99 (d, 1H, J=16.9Hz), 4.20–4.29 (m, 2H), 4.42 (d, 1H, J=11.6Hz), 4.46 (d, 1H, J=11.6Hz), 4.50–4.53 (m, 2H), 4.78 (d, 1H, J=3.4Hz), 5.14 (t, 1H, J=10.0Hz), 6.74 (d, 1H, J=9.4Hz), 6.90 (s, 1H), 7.20–7.36 (m, 20H);

Anal. Calcd. for $C_{63}H_{89}NO_{11}$ (1036. 401): C, 73.01; H, 8.66; N, 1.35; Found: C, 73.11; H, 8.68; N, 1.28.

High Resolution MS (FAB, positive) : Calcd. for $C_{63}H_{90}NO_{11}(M+H)^+$: 1036.6514, Found, 1036.6517.

(参考例36)

 $\frac{\dot{y}_{7}}{\dot{y}_{7}} = \frac{\dot{y}_{7}}{\dot{y}_{7}} + \frac{\dot$

参考例32の化合物 163mg(0.163mmo1)について参考例18と同様の操作を行うことにより、目的化合物193mg(収率:59%)が得られた。

158

IR ν_{max} (CHCl₃) 1516, 1601, 1672, 1747 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDC1₃) δ 0. 88 (t, 12H, J=6.8Hz), 1. 25-1. 68 (m, 78H), 2. 20-2. 64 (m, 8H), 3. 39-3. 49 (m, 1H), 3. 54-3. 60 (m, 1H), 3. 65-3. 89 (m, 5H), 3. 93-4. 07 (m, 3H), 4. 23-4. 28 (m, 1H), 4. 38-4. 76 (m, 10H), 4. 99 (d, 1H, J=7.8Hz), 5. 10-5. 18 (m, 2H), 5. 51-5. 62 (m, 1H), 5. 81 (d, 1H, J=6.8Hz), 6. 67 (d, 1H, J=8.8Hz), 6. 89 (s, 1H), 7. 15-7. 46 (m, 35H);

High Resolution MS(FAB, positive) : Calcd. for $C_{110}H_{157}O_{22}N_2Cl_3PFK$ (M+K)⁺: 2051.9652, Found: 2051.9609.

(参考例37)

参考例36の化合物 140mg(0.070mmo1)について参考例21と同様の操作を行うことにより、目的化合物59.9mg(収率:38%)が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 1520, 1602, 1746, 3378 cm⁻¹;

 1 H-NMR (400MHz, CDC1₃) δ 0. 88 (t, 12H, J=5. 1-6. 6Hz), 1. 25-1. 56 (m, 78H), 1. 88 (s, 3H), 2. 19-2. 66 (m, 8H), 3. 36-4. 06 (m, 11H), 4. 27-4. 67 (m, 7H), 4. 77 (d, 1H, J=3. 7Hz), 5. 14-5. 19 (m, 2H), 5. 35 (d, 1H, J=8. 1Hz), 5. 52-5. 57 (m, 1H), 6. 55 (d, 1H, J=6. 6Hz), 6. 65 (d, 1H, J=9. 5Hz), 6. 88 (s, 1H), 7. 13-7. 32 (m, 35H);

High Resolution MS (FAB, positive) : Calcd. for $C_{109}H_{158}O_{21}N_2FPNa$ (M+Na)⁺: 1904.0976, Found: 1904.0969.

(参考例38)

 $\frac{D \nu \pi + \nu \times F \nu}{D \times E \times E \times E \times E} = \frac{6 - \nu \pi + \nu}{6 - \nu} = \frac{6 - \nu \pi + \nu}{6 - \nu} = \frac{6 - \nu \pi \times E}{6 - \nu} = \frac{6 - \nu \pi$

159

|E| = |E| + |E|

参考例37の化合物 65.0mg(0.032mmo1)について参考例24と同様の操作を行うことにより、目的化合物16.7mg(収率:34%)が得られた。

IR ν_{max} (CHCl₃) 1524, 1602, 1665, 3691 cm⁻¹;

 $^{1}\text{H-NMR}$ (400MHz, CD₃OD) δ 0.85-0.87 (m, 12H), 1.19-1.49 (m, 78H), 1.85 (s, 3H),

- 2. 05-2. 08 (m, 2H), 2. 16-2. 26 (m, 2H), 2. 29-2. 42 (m, 4H), 3. 41 (t, 1H, J=9. 5Hz),
- 3.62-3.66 (m, 1H), 3.70-3.87 (m, 4H), 4.01-4.18 (m, 4H), 4.27-4.51 (m, 3H),
- 4. 80-4. 90 (m, 2H), 5. 03 (t, 1H, J=5. 0Hz), 5. 08-5. 14 (m, 1H), 5. 35 (t, 1H, J=9. 7Hz), 7. 08-7. 32 (m, 10H);

High Resolution MS (FAB, positive) : Calcd. for $C_{82}H_{136}O_{21}N_2FPNa$ (M+Na)⁺: 1557.9255, Found: 1557.9230.

(参考例39)

y = y + y + 2 - y +

アリル 2-デオキシ-4, $6-0-イソプロピリデン-2-トルフルオロアセタミド-\alpha-D-グルコピラノシド(7.21g、20.3 mm o 1)のジメチルホルムアミド(150 m L)溶液に、氷冷下で水素化ナトリウム(55%油性、2.95g、73.8 mm o 1)を加え、15分間攪拌した。この溶液に<math>1-$ メタンスルホニルオキシデカン(5.75g、24.3 mm o 1)を加え、室温で5時間攪拌した。その後、水を加えて反応を止め、酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄して、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン一酢酸エチル(4:1)で溶出すると、目的化合物(7.53g、収率75%)が得られた。

IR ν max (CHCl₃ solution) 3431, 2928, 2857, 1734, 1648 cm⁻¹; ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (3H, t, J=6.6-7.3 Hz), 1.20-1.39 (14H, m), 1.41 (3H, s), 1.44-1.48 (2H, m), 1.50 (3H, s), 3.40-3.51 (2H, m), 3.64-3.81 (4H, m), 3.85 (1H, dd, J=4.4, 10.3 Hz), 3.99 (1H, dd, J=6.6, 12.5 Hz), 4.15-4.20 (2H, m), 4.88 (1H, d, J=3.7 Hz),

160

5. 24-5. 31 (2H, m), 5. 87 (1H, m), 6. 40 (1H, d, J=8.8 Hz, NH). MS (FAB, positive) m/z 534 (M+K) $^{+}$, 496 (M+H) $^{+}$; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{24}H_{41}F_3NO_6$: 496. 2886; found: 496. 2888. Anal. Calcd. for $C_{24}H_{40}F_3NO_6$ (495. 6): C, 58. 17; H, 8. 14; N, 2. 83; F, 11. 50. Found: C, 57. 66; H, 8. 17; N, 2. 91; F, 11. 66.

(参考例40)

 \underline{r} リル $3-O-\overline{r}$ シルー $2-\overline{r}$ オキシー $4,6-O-\overline{r}$ ソプロピリデンー $2-(2-\overline{r})$ \underline{r} ウンデシルー [1,3] ジオキソランー $2-\overline{r}$ ル) \underline{r} セタミドー $\alpha-D-\overline{r}$ ルコピラノシド

参考例39の化合物(2.60g, 5.25mmol)のエタノール(12mL)溶液に1N水酸化ナトリウム水溶液(12mL)を加えて、60℃で4時間攪拌した。この溶液を酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られたアミンを塩化メチレン(20mL)に溶解した。この溶液に、(2-ウンデシルー[1,3]ジオキソランー2ーイル)酢酸(1.50g、5.24mmol)、ジシクロヘキシルカルボジイミド(1.30g、6.30mmol)、4ージメチルアミノピリジン(832mg、6.81mmol)を加えて、室温で2時間攪拌した。この溶液を濾過し、溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、ヘキサンー酢酸エチル(3:2)で溶出すると、目的化合物(3.01g、収率86%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3387, 2928, 2857, 1669 cm⁻¹; ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (6H, t, J=6.8 Hz), 1.25-1.51 (40H, m, containing 3H, s, at 1.41 ppm, 3H, s, at 1.50 ppm), 1.68-1.71 (2H, m), 2.58 (2H, s), 3.45-3.51 (2H, m), 3.64-3.77 (2H, m), 3.84 (1H, dd, J=4.9, 10.7 Hz), 3.94 (1H, m), 3.98 (4H, s), 4.14-4.20 (2H, m), 4.85 (1H, d, J=3.9 Hz), 5.19-5.32 (2H, m), 5.89 (1H, m), 6.75 (1H, d, J=8.8 Hz, NH).; MS (FAB, positive) m/z 706 (M+K)⁺, 690 (M+Na)⁺, 668 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{38}H_{70}NO_8$: 668.5101; found: 668.5098. Anal. Calcd. for $C_{38}H_{69}NO_8$ (668.0): C, 68.33; H, 10.41; N, 2.10. Found: C, 67.26; H, 9.93; N, 2.08.

(参考例41)

参考例40の化合物(1.34g、2.01mmol)を四塩化炭素(2mL)、アセトニトリル(2mL)、水(3mL)の混合溶媒に溶解し、二酸化ルテニウム水和物(6.0mg、0.045mmol)と過ヨウ素酸ナトリウム(1.76g、8.23mmol)を加えて、室温で24時間攪拌した。その後、酢酸エチルで抽出し、飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥して、減圧下溶媒を留去した。得られた粗カルボン酸をジメチルホルムアミド(10mL)に溶解し、トリエチルアミン(0.6mL,4.30mmol)、アリルブロミド(0.35mL,4.14mmol)を加えて、室温で二時間攪拌した。その後、1N塩酸水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄して、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(3:2)で溶出すると、目的化合物(1.20g、収率:82%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3386, 2928, 2856, 1757, 1669 cm⁻¹; ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (6H, t, J=6.6-7.3 Hz), 1.25-1.38 (34H, m), 1.40 (3H, s), 1.49 (3H, s), 1.70-1.75 (2H, m), 2.56, 2.64 (2H, ABq, J=14.6 Hz), 3.47-3.56 (2H, m), 3.68-3.82 (5H, m), 3.95-4.05 (4H, m), 4.13-4.23 (3H, m, containing 2H, ABq, J=16.1 Hz, at 4.15, 4.20 ppm), 4.64 (2H, d, J=5.9 Hz), 4.87 (1H, d, J=3.7 Hz), 5.25-5.36 (2H, m), 5.90 (1H, m), 6.83 (1H, d, J=8.8 Hz, NH).; MS (FAB, positive) m/z 764 (M+K)⁺, 748 (M+Na)⁺, 726 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{40}H_{72}NO_{10}$: 726.5156; found: 726.5153. Anal. Calcd. for $C_{40}H_{71}NO_{10}$ (726.0): C, 66.18; H, 9.86; N, 1.93. Found: C, 65.19; H, 9.73; N, 1.97.

(参考例42)

(PJ)ルオキシカルボニル)メチル 3-O-デシルー2-デオキシー2-(3-オキソテトラデカナミド) $-\alpha$ -D-グルコピラノシド

PCT/JP01/03005

参考例41の化合物(1.20g、1.65 mmol)を80%酢酸水溶液(6 m L)に溶解し、60℃で4時間攪拌したのち、反応液を減圧下濃縮した。酢酸エチルで希釈し、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去して、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(1:4)で溶出すると、目的化合物(898 mg、85%)が得られた。

IR (KBr) ν_{max} 3427, 3291, 3082, 2922, 2852, 1758, 1719, 1640 cm⁻¹; ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (3H, t, J=6.6 Hz), 1.25-1.59 (34H, m), 2.55 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.70 (1H, brs, OH), 3.43 (2H, s), 3.51-3.67 (5H, m, containing OH), 3.74-3.86 (3H, m), 4.18-4.24 (3H, m, containing 2H, s, at 4.23 ppm), 4.63 (2H, d, J=5.9 Hz), 4.82 (1H, d, J=3.7 Hz), 5.25-5.35 (2H, m), 5.90 (1H, m), 7.30 (1H, d, J=9.5 Hz, NH).; MS (FAB, positive) m/z 680 (M+K)⁺, 664 (M+Na)⁺, 642 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{35}H_{64}NO_9$: 642.4581; found: 642.4572. Anal. Calcd. for $C_{35}H_{63}NO_9$ (641.9): C, 65.49; H, 9.89; N, 2.18. Found: C, 65.04; H, 9.60; N, 2.22.

(参考例43)

アリル 2-デオキシ-4, 6-O-イソプロピリデン-3-O-[(R)-3-メトキシデシル] $-2-トリフルオロアセタミド-\alpha-D-グルコピラノシド$

アリル -2ーデオキシー4, 6-Oーイソプロピリデンー2ートリフルオロアセタミドー α -Dーグルコピラノシド(6. 32g、17. 8mmol)のジメチルホルムアミド(50mL)溶液に、0で水素化ナトリウム(60%油性、1. 43g、35. 8mmol)を加えて、15分間攪拌した。その後、(R) -3-メトキシー1ー(トルエンー4ースルホニルオキシ)ーデカン(6. 71g、19. 6mmol)を加えて、室温で5時間攪拌した。この溶液に水を加えて反応を止め、酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(5: 1) で溶出すると、目的化合物(8. 01g、収率:86%)が得られた。 IR (CHCl₃ solution) ν max 3429, 2930, 2859, 1733, 1648 cm $^{-1}$. 1 H-NMR(400MHz, CDCl₃)

163

 δ : 0. 88 (3H, t, J=6.6-7.3 Hz), 1. 27-1. 51 (18H, m, containing 3H, s, δ 1. 41, 3H, s, δ 1. 51), 1. 62-1. 67 (2H, m), 3. 25-3. 30 (4H, m, containing 3H, s, δ 3. 28), 3. 51-3. 60 (2H, m), 3. 67-3. 71 (2H, m), 3. 76 (1H, t, J=10.3 Hz), 3. 82-3. 88 (2H, m), 3. 98 (1H, m), 4. 13-4. 21 (2H, m), 4. 90 (1H, d, J=3. 7 Hz), 5. 24-5. 31 (2H, m), 5. 87 (1H, m), 6. 56 (1H, d, J=9. 5 Hz, NH); MS (FAB, positive) m/z 564 (M+K)⁺, 526 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive), calcd. for $C_{25}H_{43}NO_7F_3$: 526. 2992; found: 526. 2994. Anal. Calcd. for $C_{25}H_{42}NO_7F_3$ (525. 6): C, 57. 13; H, 8. 05; N, 2. 66; F, 10. 84. Found: C, 55. 59; H, 7. 65; N, 2. 63; F, 10. 62.

(参考例44)

アリル 2-デオキシ-4, $6-O-イソプロピリデン-3-O-[(R)-3-メトキシデシル]-2-(2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ) <math>-\alpha-D$ -グルコピラノシド

参考例43の化合物(7.52g、14.3mmol)のエタノール(20mL)溶液に1N水酸化ナトリウム水溶液(20mL)を加えて、60℃で5時間攪拌した。この溶液を酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られたアミンを塩化メチレン(20mL)に溶解した。この溶液に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液(20mL)とクロロギ酸2,2,2~トリクロロエチルエステル(3.60g、17.0mmol)を加えて、室温で1時間攪拌した。その後、酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で乾燥し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン-酢酸エチル(4:1)で溶出すると、目的化合物(8.39g、収率:96%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3439, 2930, 2858, 1742, 1648 cm⁻¹., ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (3H, t, J=6.6 Hz), 1.27-1.47 (15H, m, containing 3H, s, d 1.41), 1.50 (3H, s), 1.63-1.71 (2H, m), 3.25-3.32 (4H, m, containing 3H, s, d 3.30), 3.47 (1H, t, J=9.5 Hz), 3.59-3.91 (7H, m), 3.98 (1H, dd, J=6.6, 12.5 Hz), 4.17 (1H, dd, J=5.1, 12.5 Hz), 4.74 (2H, s), 4.89 (1H, d, J=3.7 Hz), 5.20-5.32 (3H, m, containing NH), 5.89 (1H, m); MS (FAB, positive) m/z 642 (M+K)⁺, 604 (M+H)⁺; High

Resolution MS (FAB, positive), calcd. for $C_{26}H_{45}NO_8Cl_3$: 604. 2202; found: 604. 2211. Anal. Calcd. for $C_{26}H_{44}NO_8Cl_3$ (605. 0): C, 51. 62; H, 7. 33; N, 2. 32; Cl, 17. 58. Found: C, 51.07; H, 7. 14; N, 2. 28; Cl, 18. 20.

(参考例45)

アリル 2-デオキシ-3-O-[(R)-3-メトキシデシル]-2-(2, 2, 2)2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ) $-\alpha-D-グルコピラノシド$

参考例44の化合物(8.20g、13.6 mmol)を80%酢酸水溶液(40 mL)に溶解し、60℃で2時間攪拌した。その後、この溶液を減圧下濃縮し、酢酸エチルで希釈して、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(2:3)で溶出すると、目的化合物(6.85g、収率:89%)が得られた。

IR (KBr) ν_{max} 3336, 3082, 2928, 2857, 1713, 1647 cm⁻¹., ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (3H, t, J=6.6-7.3 Hz), 1.27-1.32 (10H, m), 1.43 (1H, m), 1.58 (1H, m), 1.73 (2H, q, J=5.9 Hz), 2.27 (1H, brs, 0H), 3.29 (3H, s), 3.36 (1H, m), 3.47 (1H, t, J=8.8, 10.3 Hz), 3.59-3.72 (3H, m), 3.83-3.91 (4H, m), 3.97-4.02 (2H, m, containing 0H), 4.19 (1H, dd, J=5.1, 12.5 Hz), 4.69, 4.82 (2H, ABq, J=11.7 Hz), 4.87 (1H, d, J=3.7 Hz), 5.22-5.32 (3H, m, containing NH), 5.89 (1H, m); MS (FAB, positive) m/z 602 (M+K)⁺, 586 (M+Na)⁺, 564 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive), calcd. for $C_{23}H_{41}NO_8Cl_3$: 564.1898; found: 564.1893. Anal. Calcd. for $C_{23}H_{40}NO_8Cl_3$ (564.9): C, 48.90; H, 7.14; N, 2.48; C1, 18.83. Found: C, 48.94; H, 7.24; N, 2.41; C1, 18.36.

(参考例46)

 $(1-\mathcal{P}_1 \mathcal{P}_2 \mathcal{P}_3 \mathcal{P}_3 \mathcal{P}_4 \mathcal{P$

(1,5-シクロオクタジエン)ビスー(メチルジフェニルホスフィン)ーイリジウム へ

WO 01/77133

キサフルオロホスフェート(63.8 mg、0.0754 mmol)をテトラヒドロフラン(5 mL)に溶解し、水素置換してイリジウム錯体を活性化して、赤色溶液が透明になったのち、反応系を完全に窒素置換した。その後、参考例45の化合物(850 mg、1.51 mmol)を加えて、室温で3時間攪拌した。この溶液を減圧下濃縮し、真空ポンプで乾燥した。得られた残査を塩化メチレン(5 mL)に溶解し、この溶液にピリジン(0.20 mL、2.47 mmol)とクロロギ酸アリルエステル(0.24 mL、2.26 mmol)を加えて、0℃で2時間攪拌した。その後、酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン一酢酸エチル(7:3)で溶出すると、目的化合物(951 mg、収率:97%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν max 3608, 3436, 3351, 2929, 2859, 1745, 1678, 1661 cm⁻¹., 'H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (3H, t, J=6.6-7.3 Hz), 1.24-1.32 (10H, m), 1.44 (1H, m), 1.55-1.64 (4H, m), 1.69-1.75 (2H, m), 3.29 (3H, s), 3.36 (1H, m), 3.48 (1H, t, J=8.8 Hz), 3.60 (1H, m), 3.76 (1H, m), 3.80 (1H, m), 3.85-3.96 (3H, m), 4.38-4.45 (2H, m), 4.63-4.69 (3H, m), 4.84 (1H, ABq, J=11.7 Hz), 5.05 (1H, d, J=3.7 Hz), 5.17 (1H, m), 5.24 (1H, d, J=9.5 Hz, NH), 5.26-5.39 (2H, m), 5.93 (1H, m), 6.07 (0.2H, dd, J=1.5, 6.6 Hz), 6.15 (0.8H, dd, J=1.5, 12.5 Hz); MS (FAB, positive) m/z 686 (M+K)⁺, 648 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, negative), calcd. for $C_{27}H_{45}NO_{10}Cl_3$: 648.2109; found: 648.2128. Anal. Calcd. for $C_{27}H_{44}NO_{10}Cl_3$ (649.0): C, 49.97; H, 6.83; N, 2.16; C1, 16.39. Found: C, 40.73; H, 6.88; N, 2.21; C1, 16.08.

(参考例4.7)

 $(1-\mathcal{P}_1 \mathcal{P}_2 \mathcal{P}_3 \mathcal{P}_4 \mathcal{P$

参考例46の化合物 (728mg、1.12mmol) のテトラヒドロフラン (5mL) 溶液に、1H-テトラゾール (119mg、1.70mmol)、ビス (アリル

オキシ)(ジイソプロピルアミノ)ホスフィン(412mg、1.68mmol)を加えて、室温で1時間攪拌したのち、この溶液に30%過酸化水素水(2mL)を0℃で加えて、1時間攪拌した。10%チオ硫酸ナトリウム水溶液を加えて反応を止め、酢酸エチルで希釈し、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン:酢酸エチル(3:2)で溶出すると、目的化合物(764mg、収率:84%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3436, 2955, 2930, 2858, 1747, 1677 cm⁻¹., ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (3H, t, J=6.6-7.3 Hz), 1.27-1.51 (12H, m), 1.54-1.64 (3H, m), 1.66-1.79 (2H, m), 3.22-3.32 (4H, m, containing 3H, s, d 3.27), 3.62-3.75 (2H, m), 3.84-3.99 (3H, m), 4.35-4.49 (3H, m), 4.56-4.64 (6H, m), 4.67 (0.25H, m), 4.71, 4.75 (2H, ABq, J=11.7 Hz), 5.09 (0.75H, d, J=3.7 Hz), 5.11 (0.25H, d, J=3.7 Hz), 5.19 (0.75H, m), 5.24-5.39 (7H, m, containing 1H, d, J=9.5 Hz, NH, d 5.31), 5.88-5.99 (3H, m), 6.06 (0.25H, dd, J=1.5, 4.4 Hz), 6.14 (0.75H, dd, J=1.5, 12.5 Hz); MS (FAB, positive) m/z 846 (M+K)⁺, 830 (M+Na)⁺, 808 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive), calcd. for $C_{33}H_{54}NO_{13}Cl_3P$: 808.2398; found: 808.2417. Anal. Calcd. for $C_{33}H_{53}NO_{13}Cl_3P$ (809.1): C, 48.99; H, 6.60; N, 1.73; Cl, 13.15; P, 3.83. Found: C, 48.49; H, 6.56; N, 1.77; Cl, 13.22; P, 3.74.

(参考例48)

6-O- アリルオキシカルボニルー 2- デオキシー 4-O- ジアリルホスホノー 3- O-[(R)-3- メトキシデシル] -2-(2,2,2- トリクロロエトキシカルボニルアミノ) -D- グルコピラノース

参考例47の化合物(610mg、0.754mmol)のテトラヒドロフラン(3 mL)溶液に、水(0.5mL)、ヨウ素(384mg、1.51mmol)を加えて室温で10分間攪拌した。この溶液に、飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加えて反応を止め、酢酸エチルで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(1:1)で溶出すると、目的化合物(5

167

57mg、収率:96%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3598, 3435, 3316, 2954, 2931, 2858, 1746, 1651 cm⁻¹, 'H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (3H, t, J=6.6-7.3 Hz), 1.22-1.50 (12H, m), 1.68-1.76 (2H, m), 3.25 (3H, s), 3.35 (1H, m), 3.61-3.72 (2H, m), 3.85-3.96 (2H, m), 4.16 (1H, m), 4.28-4.38 (2H, m), 4.49-4.63 (8H, m, containing OH), 4.65, 4.75 (2H, ABq, J=12.5 Hz), 5.24-5.40 (7H, m), 5.87-5.99 (4H, m, containing NH); MS (FAB, positive) m/z 806 (M+K)⁺, 768 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive), calcd. for $C_{30}H_{50}NO_{13}Cl_3P$: 768.2085; found: 768.2108. Anal. Calcd. for $C_{30}H_{49}NO_{13}Cl_3P$ (769.0): C, 46.85; H, 6.42; N, 1.82; Cl, 13.83; P, 4.03. Found: C, 43.95; H, 6.59; N, 1.75; Cl, 13.88; P, 4.03.

(参考例49)

WO 01/77133

(1- プロペニル) 6-O-tert-ブチルジメチルシリルー2ーデオキシー3-O-[(R)-3-メトキシデシル]-2-(2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ)- α -D-グルコピラノシド

(1,5-シクロオクタジエン)ビス-(メチルジフェニルホスフィン)-イリジウム へキサフルオロホスフェート(84.8 mg、0.100 mm o 1)をテトラヒドロフラン(10 mL)に溶解し、水素置換してイリジウム錯体を活性化して、赤色溶液が透明になったのち、反応系を完全に窒素置換した。その後、参考例48の化合物(1.13g、2.00 mm o 1)を加えて、室温で2時間攪拌した。この溶液を減圧下濃縮し、真空ポンプで乾燥した。得られた残査を塩化メチレン(10 mL)に溶解し、この溶液にジメチルアミノピリジン(369 mg、3.02 mm o 1)、tert-ブチルジメチルシリルクロリド(453 mg、3.01 mm o 1)を加えて室温で2時間攪拌した。その後、酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(4:1)で溶出すると、目的化合物(1.31g、96%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3437, 2955, 2930, 2858, 1742, 1676 cm⁻¹., ¹H-NMR (500 MHz, CDCl₃) δ : 0.082 (6H, s), 0.87-0.96 (12H, m), 1.27-1.32 (10H, m), 1.43 (1H, m),

1. 55-1. 64 (4H, m), 1. 68-1. 76 (2H, m), 3. 30 (3H, s), 3. 35 (1H, m), 3. 48 (1H, m), 3. 60-3. 93 (8H, m, containing 0H), 4. 60-4. 79 (1. 25H, m, containing 1H, ABq, J=11. 7 Hz, d 4. 66), 4. 82 (1H, ABq, J=11. 7 Hz), 5. 05 (0. 75H, d, J=3. 9 Hz), 5. 07 (0. 25H, d, J=3. 9 Hz), 5. 15 (0. 75H, dt, J=6. 8, 12. 7 Hz), 5. 25 (1H, d, J=8. 8 Hz, NH), 6. 07 (0. 25H, dd, J=2. 0, 5. 9 Hz), 6. 15 (0. 75H, dd, J=2. 0, 12. 7 Hz); MS (FAB, positive) m/z 716 (M+K)⁺, 678 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, negative), calcd. for $C_{29}H_{55}NO_8Cl_3Si$: 678. 2763; found: 678. 2736. Anal. Calcd. for $C_{29}H_{54}NO_8Cl_3Si$: 679. 2): C, 51. 28; H, 8. 01; N, 2. 06; Cl, 15. 66. Found: C, 50. 24; H, 7. 89; N, 2. 03; Cl, 12. 95.

(参考例50)

(1- プロペニル) 6 $-O-tert-ブチルジメチルシリルー2-デオキシー4 <math>-O- \tilde{y}$ アリルホスホノー3 $-O-[(R)-3- J+ + \tilde{y}]$ -2-(2,2,2) 2 - トリクロロエトキシカルボニルアミノ) $-\alpha-D- \tilde{y}$ ルコピラノシド

参考例49の化合物(1.30g、1.91mmol)について、参考例47と同様の操作を行うことにより、目的化合物(1.35g、収率:84%)が得られた。 IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3436, 2955, 2930, 2858, 1743, 1678 cm⁻¹., ¹H-NMR(500 MHz,CDCl₃) 「**:0.053(6H, s), 0.87-0.89(12H, m), 1.26-1.31(10H, m), 1.35-1.47(2H, m), 1.54-1.65(3H, m), 1.70-1.80(2H, m), 3.23-3.28(4H, m, containing 3H, s, δ 3.27), 3.61-3.75(3H, m), 3.78-3.96(4H, m), 4.32(1H, m), 4.53-4.65(4.25H, m), 4.74(2H, s), 5.06(0.75H, d, J=3.9 Hz), 5.08(0.25H, d, J=3.9 Hz), 5.17(0.75H, m), 5.23-5.38(5H, m, containing NH), 5.90-5.98(2H, m), 6.07(0.25H, dd, J=2.0, 4.9 Hz), 6.16(0.75H, dd, J=2.0, 12.7 Hz); MS(FAB, positive)m/z 876(M+K)⁺; 860(M+Na)⁺、838(M+H)⁺; High Resolution MS(FAB, positive)m/z:calcd.for $C_{35}H_{64}NO_{11}Cl_3PSi$:838.3052; found:838.3069.Anal.Calcd.for $C_{36}H_{63}NO_{11}Cl_3PSi$ (839.3):C、50.09;H,7.57;N,1.67;Cl,12.67;P,3.69.Found:C,49.22;H,7.40;N,1.69;Cl,13.22;P,3.58.

(参考例51)

 $(1-\mathcal{T}$ ロペニル) $2-\mathcal{F}$ オキシー $4-O-\mathcal{V}$ アリルホスホノー3-O-[(R)-3-メトキシデシル]-2-(2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ)- $\alpha-D-\mathcal{V}$ ルコピラノシド

参考例50の化合物(1.15g、1.37mmol)のテトラヒドロフラン(8mL)溶液に、ふっ化水素ーピリジン(100mg)を加えて、室温で48時間攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて反応を止め、酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(2:3)で溶出すると、目的化合物(877mg、収率:88%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3436, 2956, 2931, 2859, 1744, 1676 cm⁻¹., ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 0.89 (3H, t, J=6.6-7.3 Hz), 1.27-1.52 (12H, m), 1.55-1.64 (3H, m), 1.67-1.78 (2H, m), 3.21-3.32 (4H, m, containing 3H, s, at 3.28 ppm), 3.59-3.74 (4H, m), 3.85-4.02 (4H, m, containing 0H), 4.43 (1H, m), 4.56-4.72 (5.5H, m), 4.78 (1H, ABq, J=11.7 Hz), 5.11 (0.5H, d, J=3.7 Hz), 5.14 (0.5H, d, J=3.7 Hz), 5.17 (0.5H, m), 5.26-5.42 (5H, m, containing NH), 5.89-6.07 (2H, m), 6.08 (0.5H, dd, J=1.5, 3.7 Hz), 6.15 (0.5H, dd, J=1.5, 12.5 Hz).; MS (FAB, positive) m/z 762 (M+K)⁺; 746 (M+Na)⁺, 724 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{29}H_{50}NO_{11}Cl_3P$: 724.2187; found: 724.2187.

(参考例52)

(1- プロペニル) $2- デオキシ-4-O- ジアリルホスホノ-3-O-[(R)-3-メトキシデシル]-6-O-メチル-2-(2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ) <math>-\alpha-D-$ グルコピラノシド

参考例51の化合物(845mg、1.17mmol)の塩化メチレン(8mL)溶液に、トリメチルオキソニウムテトラフルオロボレート(209mg、1.41mmol)、2,6-ジーtertーブチルー4ーメチルピリジン(289mg、1.41mmol)を加えて、室温で18時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー

酢酸エチル(1:1)で溶出すると、目的化合物(638mg、74%)が得られた。IR (CHCl₃ solution) ν max 3436, 2930, 2858, 1743, 1676 cm⁻¹., ¹H-NMR(500 MHz, CDCl₃) $^{\text{IM}}$: 0.88 (3H, t, J=6.8 Hz), 1.27-1.49 (12H, m), 1.56-1.64 (3H, m), 1.69-1.79 (2H, m), 3.23-3.29 (4H, m, containing, 3H, s, at 3.27 ppm), 3.40 (3H, s), 3.62-3.74 (4H, m), 3.79-3.88 (2H, m), 3.98 (1H, m), 4.46 (1H, m), 4.57-4.76 (6.5H, m), 5.11 (0.5H, d, J=3.9 Hz), 5.12 (0.5H, d, J=3.9 Hz), 5.13 (0.5H, m), 5.25-5.40 (5H, m, contaitning NH), 5.91-5.99 (2H, m), 6.09 (0.5H, dd, J=2.0, 3.9 Hz), 6.16 (0.5H, dd, J=2.0, 12.7 Hz).; MS (FAB, positive)m/z 776 (M+K) $^+$; 760 (M+Na) $^+$, 738 (M+H) $^+$; High Resolution MS (FAB, positive)m/z: calcd. for $C_{30}H_{52}NO_{11}Cl_3P$: 738.2344; found: 738.2348. Anal. Calcd. for $C_{30}H_{51}NO_{11}Cl_3P$ (739.1): C, 48.75; H, 6.96; N, 1.90; C1, 14.39; P, 4.19. Found: C, 48.73; H, 6.85; N, 1.84; C1, 14.29; P, 4.15.

(参考例53)

 $2 - \vec{r}$ \vec{r} $\vec{$

参考例 $5\ 2\ O$ 化合物($5\ 4\ 5\ m\ g$ 、 0 . $7\ 3\ 8\ m\ m$ o 1)について、参考例 $4\ 8\ \epsilon$ 同様の操作を行うことにより、目的化合物($4\ 7\ 5\ m\ g$ 、収率: $9\ 2\ \%$)が得られた。 IR(CHCl $_3$ solution) ν_{max} 3630,3435,2930,2857,1743, $1651\ cm^{-1}$, 1H -NMR($500\ MHz$,CDCl $_3$) δ : 0 . 88 (3H, t, J=6 . $8\ Hz$),1 . 27-1 . 48 (12H, m),1 . 68-1 . 75 (2H, m),3 . 27 (3H, s),3 . 40 (3H, s),3 . 59-3 . 75 (5H, m),3 . 85-3 . 91 (2H, m),4 . 09 (1H, brs, OH),4 . 11 (1H, m),4 . 29 (1H, m),4 . 57-4 . 62 (4H, m),4 . 70,4 . 74 (2H, ABq, J=11 . 7 Hz),5 . 25-5 . 40 (5H, m),5 . 57 (1H, d, J=9 . 8 Hz,NH),5 . 91-5 . 99 (2H, m) . ; MS(FAB, positive)m/z 736 (M+K) $^+$; 720 (M+Na) $^+$, 698 (M+H) $^+$; High Resolution MS (FAB, positive) m/z : calcd for $C_{27}H_{48}NO_{11}Cl_3P$: 698 . 2031; found: 698 . 2023 . Anal. Calcd for $C_{27}H_{47}NO_{11}Cl_3P$ (699 . 0) : C, 46 . 39; H, 6 . 78; N, 2 . 00; Cl, 15 . 22; P, 4 . 43 . Found: C, 46 . 43; H, 6 . 42; N, 2 . 00; Cl, 16 . 15; P, 4 . 32 .

(参考例54)

参考例48の化合物(531mg、0.690mmol)の塩化メチレン(5mL)溶液に、トリクロロアセトニトリル(0.35mL、3.49mmol)、炭酸セシウム(114mg、0.348mmol)を加えて、室温で3時間攪拌した。この反応液に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて、塩化メチレンで抽出し、飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた粗イミデート体(638mg、0.69mmol)と参考例42の化合物(282mg、0.439mmol)を塩化メチレン(5mL)に溶解し、モレキュラーシーブス4A(590mg)を加えて、室温で1時間攪拌し、反応系の水分を除去したのち、反応混合物を-40 に冷却して、トリフルオロメタンスルホナート(6 μ L)を加えて2時間攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて反応を止め、酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄して、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(2:3)で溶出すると、目的化合物(452mg、収率:74%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3431, 2929, 2856, 1747, 1675 cm⁻¹., ¹H-NMR (500 MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (9H, t, J=6.9 Hz), 1.17-1.80 (48H, m), 2.54 (2H, t, J=7.4 Hz), 2.72 (1H, s, OH), 3.22-3.31 (5H, m, containing, 3H, s, at 3.29 ppm), 3.39-3.48 (3H, m, containing 2H, s, at 3.42 ppm), 3.52-3.88 (9H, m), 4.06 (1H, m), 4.15-4.29 (4H, m, containing 2H, ABq, J=16.8 Hz, at 4.18, 4.22 ppm), 4.33 (1H, dd, J=5.9, 12.0 Hz), 4.54-4.75 (10H, m), 4.78 (1H, d, J=3.7 Hz), 4.79 (1H, ABq, J=12.0 Hz), 4.98 (1H, m), 5.24-5.39 (8H, m), 5.78 (1H, m), 5.86-5.97 (4H, m), 7.22 (1H, d, J=9.4 Hz, NH).; MS (FAB, positive) m/z 1429 (M+K)⁺; 1413 (M+Na)⁺, 1391 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{65}H_{110}N_2O_{21}Cl_3PNa$: 1413.6302; found: 1413.6310. Anal. Calcd. for $C_{65}H_{110}N_2O_{21}Cl_3P$ (1392.9): C, 56.05; H, 7.96; N, 2.01; Cl, 7.64; P, 2.22. Found: C, 54.40; H, 7.54; N, 1.99; Cl, 8.29; P, 2.24.

(参考例55)

WO 01/77133

(参考例56)

参考例54の化合物(330mg、0.237mmol)の酢酸(5mL)溶液に、 亜鉛粉末(328mg、5.02mmol)を加えて、室温で5時間攪拌した。その

後、反応液を濾過し、減圧下濃縮したのち、酢酸エチルで希釈して、飽和炭酸水素ナ トリウム水溶液、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶 媒を留去して得られたアミン(280mg)を、塩化メチレン(5mL)に溶解し、(Z) -11-オクタデセン酸(102mg、0.360mmol)、ジシクロヘキシルカルボジイミド (78.8 mg、0.382 mm o 1) を加えて、室温で4時間攪拌した。 反応液を濾過し、減圧下濃縮して、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、 ヘキサン-酢酸エチル(2:3)で溶出した。多少の不純物を含有していたため、さ らに薄層シリカゲルクロマトグラフィー(ヘキサン-酢酸エチル、2:3)にて精製 すると、目的化合物(88.9mg、収率:25%)が得られた。 IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3439, 3355, 3089, 2928, 2856, 1749, 1672 cm⁻¹., ¹H-NMR $(400 \text{ MHz}, \text{CDCl}_3)$ $^{\text{TM}}$: 0.88 (12H, t, J=6.6-7.3 Hz), 1.25-1.79 (70H, m), 1.99-2. 02 (4H, m), 2. 13-2. 27 (2H, m), 2. 54 (2H, t, J=7. 3-8. 1 Hz), 3. 12 (1H, m), 3. 27 (1H, m), 3.30 (3H, s), 3.34 (1H, brs, OH), 3.40 (2H, s), 3.42-3.83 (9H, m), 3.89 (1H, t, J=8.8-9.5 Hz), 4.05 (1H, m), 4.12-4.25 (4H, m, containing 2H, s, at 4.18 ppm), 4.30 (1H, dd, J=5.9, 11.7 Hz), 4.52-4.66 (9H, m), 4.80 (1H, d, J=3.7 Hz), 5. 24-5. 39 (11H, m), 5. 84-5. 98 (4H, m), 6. 27 (1H, d, J=6.6 Hz, NH), 7. 17 (1H, d, J=8.8 Hz, NH).; MS (FAB, positive) m/z 1519 (M+K)⁺; 1503 (M+Na)⁺; 1481 (M+H)⁺;

(参考例57)

found: 1503.9723.

High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd for $C_{80}H_{141}N_2O_{20}PNa$: 1503. 9713;

参考例 55 の化合物(840 m g、0.635 m m o 1)について、参考例 56 と同様の操作を行うことにより、目的化合物(316 m g、収率:35%)が得られた。 IR (CHCl₃ solution) ν max 3439, 2928, 2856, 1753, 1714, 1673 cm⁻¹., ¹H-NMR(500 MHz,CDCl₃) $^{\text{TM}}$: 0.88(12H, t, J=6.9 Hz),1.24-1.82(70H, m),1.99-2.02(4H, m),2.13-2.27

(2H, m), 2.54 (2H, t, J=7.4 Hz), 3.20-3.34 (5H, m, containing 3H, s, at 3.29 ppm), 3.38 (3H, s), 3.40 (2H, s), 3.45 (1H, t, J=9.1, 10.4 Hz), 3.51-3.88 (12H, m, containing 0H), 4.03 (1H, dd, J=2.2, 11.5 Hz), 4.13-4.20 (3H, m, containing 2H, s, at 4.17 ppm), 4.26 (1H, q, J=9.1 Hz), 4.53-4.66 (6H, m), 4.80 (1H, d, J=3.7 Hz), 5.22 (1H, d, J=8.1 Hz), 5.24-5.40 (8H, m), 5.82-5.98 (3H, m), 6.19 (1H, d, J=6.6 Hz, NH), 7.16 (1H, d, J=9.2 Hz, NH).; MS (FAB, positive) m/z 1449 (M+K)⁺; 1433 (M+Na)⁺; 1411 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{77}H_{139}N_2O_{18}PNa$: 1433.9663; found: 1433.9658.

(参考例58)

アリル 2-デオキシ-3-O-ドデシルー4, 6-O-イソプロピリデンー2-トリフルオロアセタミドー $\alpha-D-$ グルコピラノシド

アリル 2-デオキシ-4, $6-0-イソプロピリデン-2-トリフルオロアセタミド-\alpha-D-グルコピラノシド(7.22g、20.3 mmol) のジメチルホルムアミド(<math>100mL$)溶液に、氷冷下で水素化ナトリウム(60%油性、1.63g、40.8 mmol) を加え、15分間攪拌した。この溶液に<math>1-メタンスルホニルオキシドデカン(<math>6.45g、24.4 mmol) を加え、室温で5時間攪拌した。その後、水を加えて反応を止め、酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄して、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン-酢酸エチル(<math>4:1)で溶出すると、目的化合物(8.01g、収率7.5%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3431, 2927, 2856, 1734, 1648 cm⁻¹; ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (3H, t, J=6.6-7.3 Hz), 1.24-1.30 (18H, m), 1.41 (3H, s), 1.41-1.50 (2H, m), 1.50 (3H, s), 3.40-3.51 (2H, m), 3.67-3.81 (4H, m), 3.86 (1H, dd, J=5.1, 10.3 Hz), 3.99 (1H, dd, J=6.6, 13.2 Hz), 4.15-4.20 (2H, m), 4.88 (1H, d, J=3.7 Hz), 5.24-5.32 (2H, m), 5.87 (1H, m), 6.40 (1H, d, J=9.5 Hz, NH). MS (FAB, positive) m/z 562 (M+K)⁺, 524 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{26}H_{45}F_3NO_6$: 524.3199; found: 524.3204. Anal. Calcd. for $C_{26}H_{44}F_3NO_6$ (523.6): C, 59.64; H, 8.47; N, 2.67; F, 10.88. Found: C, 58.73; H, 8.13; N, 2.66; F, 10.41.

(参考例59)

参考例 580化合物(7.88g, 15.0 mmol)のエタノール(20mL)溶液に1N水酸化ナトリウム水溶液(20mL)を加えて、60℃で4時間攪拌した。この溶液を酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。滅圧下溶媒を留去し、得られたアミンを塩化メチレン(80mL)に溶解した。この溶液に、(2-ウンデシルー[1,3]ジオキソランー2-イル)酢酸(5.17g、18.1mmol)、ジシクロヘキシルカルボジイミド(4.64g、22.5mmol)、4-ジメチルアミノピリジン(2.75g、22.5mmol)を加えて、室温で2時間攪拌した。この溶液を濾過し、溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、ヘキサンー酢酸エチル(3:2)で溶出すると、目的化合物(9.12g、収率87%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3385, 2927, 2855, 1668 cm⁻¹; ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (6H, t, J=6.8 Hz), 1.25-1.37 (38H, m), 1.41 (3H, s), 1.50 (3H, s), 1.67-1.71 (2H, m), 2.58 (2H, s), 3.45-3.52 (2H, m), 3.64-3.77 (4H, m), 3.84 (1H, dd, J=4.4, 10.3 Hz), 3.92 (1H, dd, J=5.9, 12.5 Hz), 3.98 (4H, s), 4.14-4.21 (2H, m), 4.85 (1H, d, J=3.7 Hz), 5.19-5.32 (2H, m), 5.89 (1H, m), 6.75 (1H, d, J=9.5 Hz, NH).; MS (FAB, positive) m/z 734 (M+K)⁺, 718 (M+Na)⁺, 696 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{40}H_{74}NO_8$: 696.5414; found: 696.5424. Anal. Calcd. for $C_{40}H_{73}NO_8$ (696.0): C, 69.03; H, 10.57; N, 2.01. Found: C, 69.54; H, 10.50; N, 2.12.

(参考例60)

参考例59の化合物(8.00g、11.5mmol)を四塩化炭素(20mL)、アセトニトリル(20mL)、水(30mL)の混合溶媒に溶解し、二酸化ルテニウム水和物(34.5mg、0.259mmol)と過ヨウ素酸ナトリウム(10.0g、46.8mmol)を加えて、室温で48時間攪拌した。その後、酢酸エチルで抽出し、飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥して、減圧下溶媒を留去した。得られた粗カルボン酸をジメチルホルムアミド(60mL)に溶解し、トリエチルアミン(3.5mL,25.1mmol)、アリルブロミド(2.0mL,23.6mmol)を加えて、室温で3時間攪拌した。その後、1N塩酸水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄して、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン一酢酸エチル(3:2)で溶出すると、目的化合物(5.90g、収率:68%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3385, 2927, 2855, 1757, 1668 cm⁻¹; ¹H-NMR (500MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (6H, t, J=6.9 Hz), 1.25-1.39 (38H, m), 1.40 (3H, s), 1.49 (3H, s), 1.67-1.78 (2H, m), 2.57, 2.64 (2H, ABq, J=14.7 Hz), 3.48-3.56 (2H, m), 3.67-3.85 (5H, m), 3.93-4.07 (4H, m), 4.14-4.22 (3H, m, containing 2H, ABq, J=16.5 Hz, at 4.15, 4.20 ppm), 4.64 (2H, d, J=5.9 Hz), 4.87 (1H, d, J=3.7 Hz), 5.26-5.35 (2H, m), 5.91 (1H, m), 6.84 (1H, d, J=8.9 Hz, NH).; MS (FAB, positive) m/z 792 (M+K)⁺, 776 (M+Na)⁺, 754 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{42}H_{76}NO_{10}$: 754.5469; found: 754.5460. Anal. Calcd. for $C_{42}H_{75}NO_{10}$ (754.1): C, 66.90; H, 10.03; N, 1.86. Found: C, 66.48; H, 9.74; N, 1.83.

(参考例61)

参考例 60 の化合物(1.76 g、2.33 mm o1)を 80 %酢酸水溶液(15 m L)に溶解し、60 ℃で 6 時間攪拌したのち、反応液を減圧下濃縮した。酢酸エチルで希釈し、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去して、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて

177

精製し、ヘキサンー酢酸エチル(1:4)で溶出すると、白色固体として目的化合物 (1.21mg、78%)が得られた。

IR (KBr) ν_{max} 3445, 3289 (broad), 3085, 2920, 2851, 1730, 1714, 1639 cm⁻¹; ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (3H, t, J=6.6 Hz), 1.25-1.59 (38H, m), 2.10 (1H, brs, 0H), 2.55 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.63 (1H, d, J=2.9 Hz, 0H), 3.43 (2H, s), 3.51-3.68 (4H, m), 3.75-3.84 (3H, m), 4.18-4.25 (3H, m, containing 2H, s, at 4.23 ppm), 4.63 (2H, d, J=5.9 Hz), 4.82 (1H, d, J=3.7 Hz), 5.26-5.35 (2H, m), 5.89 (1H, m), 7.31 (1H, d, J=8.8 Hz, NH).; MS (FAB, positive) m/z 680 (M+K)⁺, 664 (M+Na)⁺, 642 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{37}H_{68}NO_9$: 670.4894; found: 670.4899. Anal. Calcd. for $C_{37}H_{67}NO_9$ (669.9): C, 66.34; H, 10.08; N, 2.09. Found: C, 66.01; H, 10.41; N, 1.93.

(参考例62)

 $(1-\mathcal{J}^2 - \mathcal{J}^2 - \mathcal{J}^2$

(1,5-シクロオクタジエン)ビスー(メチルジフェニルホスフィン)ーイリジウム へキサフルオロホスフェート(6 3 4 m g、0.750 m m o 1)をテトラヒドロフラン(200 m L)に溶解し、水素置換してイリジウム錯体を活性化し、赤色溶液が透明になったのち、反応系を完全に窒素置換した。この溶液に、アリル 2ーアジドー2ーデオキシー4,6ー〇ーイソプロピリデンー β -Dーグルコピラノシド(2 1.4 g、75.0 m m o 1)を加えて、室温で5時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(3:2)で溶出すると、目的化合物(2 0.8 g、収率:9 7%)が得られた。 IR(CHCl $_3$ solution) ν_{\max} 3594,2890,2116 cm $^{-1}$; 1 H-NMR(400MHz,CDCl $_3$) δ :1.43 (3H, s),1.52 (3H, s),1.58 (2.4H, dd, J=2.2, 6.6 Hz),1.64 (0.6 Hz, dd, J=2.2, 6.6 Hz),2.86 (1H, brs, OH),3.27 (1H, m),3.42-3.64 (3H, m),3.81 (1H, t, J=10.3, 11.0 Hz),3.95 (1H, dd, J=5.1, 11.0 Hz),4.55 (1H, d, J=8.1 Hz),4.66 (0.2H, m),5.22 (0.8H, m),6.18 (0.2 H, dd, J=2.2, 6.6 Hz),6.23 (0.8H, dd, J=2.2, 12.5 Hz);

MS (FAB, positive) m/z 324 (M+K)⁺, 308 (M+Na)⁺, 286 (M+H)⁺; High Resolution MS

178

(FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{12}H_{20}N_3O_5$: 286.1403; found: 286.1410. Anal. Calcd. for $C_{12}H_{19}N_3O_5$ (285.3): C, 50.52; H, 6.71; N, 14.73. Found: C, 49.05; H, 6.49; N, 14.38.

(参考例63)

(1- プロペニル) $2- アジド-2- デオキシ-4, 6-O- イソプロピリデン <math>-3-O-[(R)-3-[(Z)-7- テトラデセニルオキシ]テトラデシル]-\beta-$ D-グルコピラノシド

参考例 6 2 の化合物 (1 2. 9 g、 4 5. 2 mm o l) のジメチルホルムアミド (1 50 m L) 溶液に、0℃で水素化ナトリウム (60%油性、3.62g、90.5 m mol)を加えて、15分間攪拌した。その後、1-メタンスルホニルオキシー(R) -3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]テトラデカン(20.6g、41.0m)mol) を加えて、室温で20時間攪拌した。この溶液に水を加えて反応を止め、酢 酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下 溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エ チル(5:1)で溶出すると、目的化合物(22.2g、収率:78%)が得られた。 IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 2928, 2856, 2115 cm⁻¹., ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (6H, t, J=6.6 Hz), 1.26-1.37 (36H, m), 1.40 (3H, s), 1.49 (3H, s), 1.57 (2.4H, dd, J=1.5, 6.6 Hz), 1.64 (0.6H, dd, J=2.2, 6.6 Hz), 1.69-1.75 (2H, m), 1.97-2. 02 (4H, m), 3. 19-3. 27 (2H, m), 3. 36-3. 46 (4H, m), 3. 62 (1H, t, J=9.5 Hz), 3. 72 (1H, m), 3.78 (1H, t, J=10.3, 11.0 Hz), 3.86-3.94 (2H, m), 4.45 (1H, d, J=8.1 Hz), 4.64 (0.2H, m), 5.19 (0.8H, m), 5.34-5.39 (2H, m), 6.16 (0.2H, dd, J=2.2, 6.6 Hz), 6.21 (0.8H, dd, J=2.2, 12.5 Hz); MS (FAB, positive) m/z 730 (M+K)⁺, 692 $(M+H)^+$; High Resolution MS (FAB, positive), calcd. for $C_{40}H_{74}N_3O_6$: 692. 5578; found: 692. 5553. Anal. Calcd. for $C_{40}H_{73}N_3O_6$ (692.0): C, 69.42; H, 10.63; N, 6.07. Found: C, 68.64; H, 10.60; N, 6.05.

(参考例64)

(1-プロペニル) 2-デオキシー4,6-O-イソプロピリデン-3-O-

参考例63の化合物(10.4g、15.0mmol)のテトラヒドロフラン(7 5 m L) 溶液に、0℃で水素化リチウムアルミニウム (8 5 5 m g、 2 2. 5 m m o 1)を加え、室温で1時間攪拌した。この溶液に、ジエチルエーテル75mLを加え た後、0℃で水 (1mL)、15%水酸化ナトリウム水溶液 (1mL)、水 (3mL) を順次加えて反応を止め、セライト濾過して不溶物を除去した。濾液をエーテルで抽 出し、水、飽和食塩水で洗浄して、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮して得ら れたアミンを塩化メチレン (50 m L) に溶解した。この溶液に、飽和炭酸水素ナト リウム水溶液(50mL)とクロロギ酸2,2,2-トリクロロエチルエステル(4. 80g、22.7mmol)を加えて、室温で1時間攪拌した。その後、酢酸エチル で希釈し、水、飽和食塩水で乾燥し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留 去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(4: 1)で溶出すると、目的化合物(11.9g、収率:94%)が得られた。 IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3454, 2928, 2856, 1739, 1679 cm⁻¹., ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ: 0.88 (6H, t, J=6.6 Hz), 1.26-1.32 (36H, m), 1.40 (3H, s), 1.49 (3H, s), 1.53 (2.4H, dd, J=1.5, 6.6 Hz), 1.57 (0.6H, dd, J=1.5, 6.6 Hz), 1.66-1.72 (2H, m), 1.97-2.02 (4H, m), 3.29-3.42 (5H, m), 3.59-3.66 (2H, m), 3.76-3.86 (3H, m), 3.94 (1H, dd, J=5.1, 11.0 Hz), 4.56 (0.2H, m), 4.73 (2H, s), 4.92 (0.2H, d, J=7.3 Hz), 4.96 (0.8H, d, J=7.3 Hz), 5.12 (0.8H, m), 5.31-5.39 (3H, m, containing NH), 6.13 (0.2H, dd, J=1.5, 6.6 Hz), 6.17 (0.8H, dd, J=1.5, 11.7 Hz); MS (FAB, positive) m/z 878 (M+K)⁺, 840 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive), calcd for $C_{43}H_{76}NO_8Cl_3K$: 878. 4274; found: 878. 4260. Anal. Calcd. for $C_{43}H_{76}NO_8Cl_3$ (841. 4): C, 61.38; H, 9.10; N, 1.66; Cl, 12.64. Found: C, 61.87; H, 9.49; N, 1.75; Cl, 13.11.

(参考例65)

 $(1-\mathcal{T}^2 \mathcal{C}^2 \mathcal{C}^2 \mathcal{C}^2)$ $(1-\mathcal{T}^2 \mathcal{C}^2 \mathcal{C}^2)$ $(2-\mathcal{C}^2)$ $(2-\mathcal{C$

参考例 64 の化合物(11.5g、13.7mmol)のメタノール(70mL)溶液に、p-hルエンスルホン酸(520mg、2.74mmol)を加えて、室温で1時間攪拌した。その後、この溶液を減圧下濃縮し、酢酸エチルで希釈して、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン一酢酸エチル(1:1)で溶出すると、目的化合物(9.25g、収率:84%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3601, 3450, 3350, 2928, 2856, 1741, 1679 cm⁻¹., ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (6H, t, J=6.6-7.3 Hz), 1.26-1.46 (36H, m), 1.53 (2.4H, dd, J=2.2, 6.6 Hz), 1.57 (0.6H, dd, J=2.2, 6.6 Hz), 1.69-1.78 (2H, m), 1.97-2.02 (4H, m), 2.33 (1H, brs, 0H), 3.32-3.47 (5H, m), 3.55-3.73 (3H, m), 3.78-3.95 (4H, m, containing 0H), 4.57 (0.2H, m), 4.75 (2H, s), 4.86 (0.2H, d, J=8.1 Hz), 4.91 (0.8H, d, J=7.3 Hz), 5.10 (0.8H, m), 5.31-5.39 (3H, m, containing NH), 6.14 (0.2H, dd, J=2.2, 6.6 Hz), 6.19 (0.8H, dd, J=2.2, 12.5 Hz); MS (FAB, positive) m/z 838 (M+K)⁺, 822 (M+Na)⁺, 800 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive), calcd. for $C_{40}H_{72}NO_8Cl_3Na$: 822.4221; found: 822.4219. Anal. Calcd. for $C_{40}H_{72}NO_8Cl_3$ (801.4): C, 59.95; H, 9.06; N, 1.75; Cl, 13.27. Found: C, 59.74; H, 9.24; N, 1.82; Cl, 14.19.

(参考例66)

(1- プロペニル) 6 $-O- アリルオキシカルボニルー2-デオキシー3-O- [(R) -3-[(Z) -7-テトラデセニルオキシ]テトラデシル]-2-(2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ) <math>-\beta-D-$ グルコピラノシド

参考例 65 の化合物(3.21g、4.01 mm o1)の塩化メチレン(15 mL)溶液に、ピリジン(0.50 mL、6.18 mm o1)とクロロギ酸アリルエステル(0.51 mL、4.81 mm o1)を加えて、0 C で 1 時間攪拌した。その後、塩化メチレンで希釈し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン一酢酸エチル(3:1)で溶出すると、目的化合物(3.35g、収率:94%)が得られ

181

た。

WO 01/77133

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3451, 3350, 2928, 2856, 1746, 1679 cm⁻¹., ¹H-NMR (500MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (6H, t, J=6.9 Hz), 1.26-1.45 (36H, m), 1.53 (2.4H, dd, J=1.2, 6.8 Hz), 1.56 (0.6H, dd, J=1.2, 6.8 Hz), 1.70-1.78 (2H, m), 1.96-2.03 (4H, m), 3.31-3.43 (4H, m), 3.51 (1H, m), 3.58 (1H, m), 3.65-3.74 (2H, m), 3.79 (1H, brs, 0H), 3.87 (1H, m), 4.38 (1H, dd, J=5.7, 11.7 Hz), 4.49 (1H, dd, J=1.8, 11.7 Hz), 4.56 (0.2H, m), 4.63 (2H, d, J=5.8 Hz), 4.74 (2H, s), 4.83-4.89 (1H, m), 5.10 (0.8H, m), 5.26-5.40 (5H, m, containing NH), 5.92 (1H, m), 6.16 (0.2H, dd, J=1.7, 6.3 Hz), 6.20 (0.8H, dd, J=1.5, 12.3 Hz); MS (FAB, positive) m/z 922 (M+K)⁺, 906 (M+Na)⁺, 884 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, negative), calcd. for $C_{44}H_{76}NO_{10}Cl_3Na$: 906.4433; found: 906.4433. Anal. Calcd. for $C_{44}H_{76}NO_{10}Cl_3$ (885.4): C, 59.69; H, 8.65; N, 1.58; Cl, 12.01. Found: C, 59.72; H, 8.81; N, 1.61; Cl, 12.18.

(参考例67)

参考例 6 6 の化合物(3.00g、3.39 mmol)のテトラヒドロフラン(15 mL)溶液に、1H-テトラゾール(3 5 6 mg、5.08 mmol)、ビス(アリルオキシ)(ジイソプロピルアミノ)ホスフィン(1.00g、4.08 mmol)を加えて、室温で 2 時間攪拌したのち、この溶液に 30%過酸化水素水(5 mL)を0℃で加えて、1 時間攪拌した。10%チオ硫酸ナトリウム水溶液を加えて反応を止め、酢酸エチルで希釈し、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン:酢酸エチル(7:3)で溶出すると、目的化合物(3.02g、収率:85%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3450, 2928, 2856, 1746, 1679 cm⁻¹., ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (6H, t, J=6.6 Hz), 1.26-1.45 (36H, m), 1.52 (2.4H, dd, J=1.5, 7.3 Hz),

1.56 (0.6H, dd, J=1.5, 7.3 Hz), 1.71-1.74 (2H, m), 1.96-2.02 (4H, m), 3.28-3.38 (4H, m), 3.71-3.81 (3H, m), 3.93 (1H, m), 4.28-4.39 (2H, m), 4.51-4.64 (7.2H, m), 4.70, 4.75 (2H, ABq, J=11.7 Hz), 5.01-5.05 (1H, m), 5.09 (0.8H, m), 5.24-5.39 (8H, m), 5.53 (1H, brs, NH), 5.88-5.99 (3H, m), 6.13 (0.2H, dd, J=1.5, 5.9 Hz), 6.17 (0.8H, dd, J=1.5, 12.5 Hz); MS (FAB, positive) m/z 1082 (M+K) $^+$, 1066 (M+Na) $^+$, 1044 (M+H) $^+$; High Resolution MS (FAB, positive), calcd. for $C_{50}H_{86}NO_{13}Cl_3P$: 1044.4902; found: 1044.4929.

(参考例68)

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3598, 3435, 2928, 2856, 1747, 1651 cm⁻¹., ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (6H, t, J=6.6 Hz), 1.21-1.50 (36H, m), 1.70-1.73 (2H, m), 1.99-2.02 (4H, m), 3.27-3.36 (2H, m), 3.63-3.69 (2H, m), 3.83-3.91 (2H, m), 4.17 (1H, m), 4.30-4.37 (2H, m), 4.49-4.63 (8H, m, containing 0H), 4.73 (2H, s), 5.23-5.39 (9H, m), 5.54 (1H, d, J=8.8 Hz, NH), 5.87-5.98 (3H, m); MS (FAB, positive) m/z 1042 (M+K)⁺, 1026 (M+Na)⁺, 1004 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive), calcd. for $C_{47}H_{82}NO_{13}Cl_3P$: 1004.4589; found: 1004.4587. Anal. Calcd. for $C_{47}H_{81}NO_{13}Cl_3P$ (1005.5): C, 56.14; H, 8.12; N, 1.39; Cl, 10.58; P, 3.08. Found: C, 57.09; H, 8.27; N, 1.56; Cl, 10.31; P, 3.01.

(参考例69)

(1- プロペニル) 6-O-tert-ブチルジメチルシリル-2-デオキシー 3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]テトラデシル]-2-(2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ) - β -D-グルコピラノシド

参考例 65 の化合物 $(5.21g、6.50 \, \text{mmol})$ の塩化メチレン $(10 \, \text{mL})$ 溶液に、ジメチルアミノピリジン $(1.03g \, 8.43 \, \text{mmol})$ 、 tert-ブチ ルジメチルシリルクロリド $(1.18g \, 7.83 \, \text{mmol})$ を加えて室温で 3 時間 攪拌した。その後、塩化メチレンで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル (4:1) で溶出すると、目的化合物 $(5.72g \, 96\%)$ が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3453, 2954, 2929, 2857, 1741, 1680 cm⁻¹., ¹H-NMR (500 MHz, CDCl₃) δ : 0.020 (6H, s), 0.69-0.94 (15H, m), 1.17-1.34 (36H, m), 1.44 (2.4H, dd, J=2.0, 6.8 Hz), 1.47 (0.6H, dd, J=2.0, 6.8 Hz), 1.65-1.67 (2H, m), 1.88-1.93 (4H, m), 3.22-3.34 (5H, m), 3.47-3.56 (2H, m), 3.61 (1H, brs, 0H), 3.70-3.72 (2H, m), 3.77-3.82 (2H, m), 4.46 (0.2H, m), 4.65 (2H, s), 4.73-4.78 (1H, m), 4.99-5.03 (0.8H, m), 5.18 (1H, brs, NH), 5.23-5.30 (2H, m), 6.05 (0.2H, dd, J=2.0, 5.9 Hz), 6.10 (0.8H, dd, J=2.0, 10.7 Hz); MS (FAB, positive) m/z 952 (M+K)⁺, 936 (M+Na)⁺; High Resolution MS (FAB, negative), calcd. for $C_{46}H_{86}NO_8Cl_3SiNa$: 936.5086; found: 936.5078. Anal. Calcd. for $C_{46}H_{86}NO_8Cl_3Si$ (915.6): C, 60.34; H, 9.47; N, 1.53; C1, 11.62. Found: C, 59.87; H, 9.59; N, 1.66; C1, 12.11.

(参考例70)

 $(1-\mathcal{T}^2 - \mathcal{T}^2 - \mathcal{T}^2$

参考例69の化合物(5.52g、6.03mmol)について、参考例67と同様の操作を行うことにより、目的化合物(5.33g、収率:82%)が得られた。

IR(CHCl₃ solution) ν_{max} 3450, 2954, 2929, 2856, 1739, 1680 cm⁻¹., ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 0.050 (6H, s), 0.86-0.89 (15H, m), 1.26-1.31 (36H, m), 1.52 (2.4H, dd, J=1.5, 6.6 Hz), 1.56 (0.6H, dd, J=1.5, 7.3 Hz), 1.72-1.78 (2H, m), 1.96-2.02 (4H, m), 3.28-3.38 (4H, m), 3.57 (1H, m), 3.70-3.79 (3H, m), 3.87 (1H, m), 4.02 (1H, m), 4.28 (1H, q, J=8.8 Hz), 4.54-4.58 (4.2 Hz, m), 4.73 (2H, s), 4.95-4.97 (1H, m), 5.08 (0.8H, m), 5.23-5.39 (6H, m), 5.46 (1H, brs, NH), 6.11 (0.2H, dd, J=1.5, 6.6 Hz), 6.17 (0.8H, dd, J=1.5, 12.5 Hz); MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{52}H_{96}NO_{11}Cl_3PSi$: 1074.5556; found: 1074.5549.

(参考例71)

(1- プロペニル) $2- デオキシ-4-O- ジアリルホスホノ-3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]テトラデシル]-2-(2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニルアミノ) <math>-\alpha-D-$ グルコピラノシド

参考例 70 の化合物(4.02g、3.74 mm o 1)のテトラヒドロフラン(15 m L)溶液に、ふっ化水素ーピリジン(200 m g)を加えて、室温で26 時間攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて反応を止め、酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー酢酸エチル(3:2)で溶出すると、目的化合物(3.35g、収率:93%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3451, 2928, 2856, 1739, 1679 cm⁻¹., ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (6H, t, J=6.6 Hz), 1.26-1.39 (36H, m), 1.52 (2.4H, dd, J=1.5, 7.3 Hz), 1.56 (0.6H, dd, J=1.5, 6.6 Hz), 1.68-1.75 (2H, m), 1.97-2.03 (4H, m), 3.24-3.45 (5H, m), 3.67-3.74 (2H, m, containing OH), 3.80-3.95 (4H, m), 4.36 (1H, q, J=9.5 Hz), 4.55-4.64 (4.2H, m), 4.70, 4.75 (2H, ABq, J=12.1 Hz), 5.02 (1H, m), 5.05-5.12 (0.8H, m), 5.25-5.42 (6H, m), 5.48 (1H, brs, NH), 5.89-5.98 (2H, m), 6.13 (0.2H, dd, J=1.5, 6.6 Hz), 6.18 (0.8H, dd, J=1.5, 12.5 Hz); MS (FAB, positive) m/z 998 (M+K)⁺; 982 (M+Na)⁺, 960 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{46}H_{81}NO_{11}Cl_3PNa$: 982.4511; found: 982.4482. Anal. Calcd. for $C_{46}H_{81}NO_{11}Cl_3P$ (961.5):

185

C, 57. 46; H, 8. 49; N, 1. 46; C1, 11. 06; P, 3. 22. Found: C, 55. 46; H, 8. 29; N, 1. 43; C1, 11. 11; P, 3. 08.

(参考例72)

 $(1- \mathcal{C} - \mathcal$

参考例71の化合物(3.15g、3.28mmol)の塩化メチレン(10mL) 溶液に、トリメチルオキソニウムテトラフルオロボレート(728mg、4.92m mo1), 2, $6-\tilde{y}-tert-\tilde{y}+v-4-y+v+2$ 7mmo1)を加えて、室温で4時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水、 飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。 減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー 酢酸エチル(3:2)で溶出すると、目的化合物(2.88g、90%)が得られた。 IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3450, 2928, 2856, 1741, 1679 cm⁻¹., ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (6H, t, J=6.6 Hz), 1.26-1.45 (36H, m), 1.52 (2.4H, dd, J=1.5, 6.6 Hz), 1. 56 (0. 6H, dd, J=1. 5, 6. 6 Hz), 1. 72-1. 74 (2H, m), 1. 96-2. 02 (4H, m), 3. 27-3. 40 (7H, m, containing 3H, s, at 3.38 ppm), 3.61-3.66 (2H, m), 3.68-3.81 (3H, m), 3.91 (1H, m), 4.35 (1H, q, J=9.5 Hz), 4.53-4.59 (4.2 H, m), 4.68-4.77 (2H, m), 4. 99-5. 05 (1H, m), 5. 08 (0. 8H, m), 5. 24-5. 40 (6H, m), 5. 48 (1H, m, NH), 6. 15 (0. 2H, dd, J=1.5, 6.6 Hz), 6.19 (0.8H, dd, J=1.5, 12.5 Hz); MS (FAB, positive) m/z 1012 (M+K)⁺; 996 (M+Na)⁺, 974 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{47}H_{84}NO_{11}Cl_3P$: 974. 4848; found: 974. 4848. Anal. Calcd. for $C_{47}H_{83}NO_{11}Cl_3P$ (975. 5): C, 57.87; H, 8.58; N, 1.44; Cl, 10.90; P, 3.18. Found: C, 57.97; H, 8.55; N, 1.58; Cl, 11.11; P, 10.90.

(参考例73)

ロロエトキシカルボニルアミノ) - D - グルコピラノース

参考例 7 2 の化合物(2. 5 5 g、2. 6 1 mm o 1)について、参考例 6 8 と同様の操作を行うことにより、目的化合物(2. 0 4 g、収率:8 4 %)が得られた。 $IR(CHCl_3 \text{ solution}) \nu_{\text{max}} 3600$, 3435, 2929, 2856, 1742 cm^{-1} ., $^1\text{H-NMR}$ (500 MHz, $CDCl_3$) δ δ : 0. 88 (6H, t, J=6.6-7.3 Hz), 1. 26-1. 52 (36H, m), 1. 70-1. 75 (2H, m), 1. 96-2. 02 (4H, m), 3. 26-3. 37 (3H, m), 3. 40 (3H, s), 3. 61-3. 73 (4H, m), 3. 83-3. 92 (2H, m), 4. 11 (1H, m), 4. 29 (1H, q, J=9.5 Hz), 4. 56-4. 62 (4H, m), 4. 73 (2H, s), 5. 24-5. 40 (8H, m, containing NH), 5. 90-6. 00 (2H, m); MS (FAB, positive) m/z 972 (M+K) $^+$; 956 (M+Na) $^+$, 934 (M+H) $^+$; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{44}H_{79}NO_{11}Cl_3PNa$: 956. 4341; found: 956. 4354.

(参考例74)

参考例 680化合物(828 mg、0.824 mm o 1)の塩化メチレン(5 m L)溶液に、トリクロロアセトニトリル(0.50 m L、4.99 mm o 1)、炭酸セシウム(54 mg、0.165 mm o 1)を加えて、室温で1時間攪拌した。この反応液に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて、塩化メチレンで抽出し、飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた粗イミデート体(951 mg、0.824 mm o 1)と参考例 61 の化合物(452 mg、0.675 mm o 1)を塩化メチレン(5 m L)に溶解し、モレキュラーシーブス4A(750 mg)を加えて、室温で1時間攪拌し、反応系の水分を除去したのち、反応混合物を-40 に冷却して、トリフルオロメタンスルホナート(8μ L、0.044 mm o 1)を加えて2時間攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて反応を止め、酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄して、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサンー

酢酸エチル (3:2) で溶出すると、目的化合物 (800mg、収率:72%) が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3445, 2928, 2856, 1747, 1676 cm⁻¹., ¹H-NMR (500 MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (12H, t, J=6.9 Hz), 1.26-1.77 (76H, m), 1.99-2.03 (4H, m), 2.54 (2H, t, J=7.4 Hz), 2.79 (1H, d, J=3.3 Hz, OH), 3.23-3.29 (2H, m), 3.34-3.36 (2H, m), 3.42 (2H, s), 3.46 (1H, t, J=9.2, 10.1 Hz), 3.53 (1H, td, J=3.3, 9.4 Hz), 3.60-3.64 (2H, m), 3.68-3.72 (2H, m), 3.74-3.89 (4H, m), 4.06 (1H, m), 4.15-4.29 (5H, m, containing 2H, s, at 4.20 ppm), 4.33 (1H, dd, J=5.9, 11.9 Hz), 4.54-4.67 (8H, m), 4.71, 4.76 (2H, ABq, J=12.0 Hz), 4.78 (1H, d, J=3.7 Hz), 4.92 (1H, m), 5.24-5.39 (10H, m), 5.63 (1H, m, NH), 5.86-5.97 (4H, m), 7.24 (1H, d, J=9.3 Hz, NH); MS (FAB, positive) m/z 1693 (M+K)⁺; 1677 (M+Na)⁺; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{84}H_{146}N_2O_{21}Cl_3PNa$: 1677.9119; found: 1677.9060. Anal. Calcd. for $C_{84}H_{146}N_2O_{21}Cl_3P$ (1657.4): C, 60.87; H, 8.88; N, 1.69; C1, 6.42; P, 1.87. Found: C, 62.01; H, 9.13; N, 1.67; C1, 5.99; P, 1.78.

(参考例75)

参考例 7 3 の化合物(7 8 0 m g、0. 8 3 4 m m o 1)について、参考例 7 4 と同様の操作を行うことにより、目的化合物(5 9 4 m g、収率:5 5 %)が得られた。 $IR(CHCl_3 \text{ solution}) \nu_{\text{max}} 3443$, 3355, 2928, 2856, 1747, 1675 cm⁻¹., 1H -NMR(400 MHz, $CDCl_3$) δ :0.88(12H, t, J=6.6-7.3 Hz),1.26-1.59(74H, m),1.74(2H, q, J=6.6 Hz),1.97-2.02(4H, m),2.54(2H, t, J=7.3 Hz),2.89(1H, d, J=3.7 Hz,OH),3.21-3.36(4H, m),3.39(3H, s),3.41(2H, s),3.46(1H, t,J=9.5,10.3 Hz),3.54-3.83(11H, m),4.04(1H, m),4.17(1H, dt,J=3.7,9.5 Hz),4.20(2H, s),4.30(1H, q,J=9.5 Hz),4.55-4.65(6H, m),4.71,4.76(2H, ABq,J=12.1 Hz),4.78

188

(1H, d, J=3.7 Hz), 4.86 (1H, m), 5.24-5.39 (8H, m), 5.52 (1H, m, NH), 5.85-5.99 (3H, m), 7.20 (1H, d, J=9.5 Hz, NH); MS (FAB, positive) m/z 1623 (M+K) $^+$; 1607 (M+Na) $^+$, 1585 (M+H) $^+$; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{81}H_{144}N_2O_{19}Cl_3PNa$: 1607.9064; found: 1607.9059. Anal. Calcd. for $C_{81}H_{144}N_2O_{19}Cl_3P$ (1587.3): C, 61.29; H, 9.14; N, 1.76; C1, 6.70; P, 1.95. Found: C, 60.92; H, 9.14; N, 2.21; C1, 7.04; P, 1.98.

(参考例76)

参考例74の化合物(370mg、0.223mmol)のテトラヒドロフラン(3 mL)溶液に、酢酸 (2mL)、亜鉛粉末 (293mg、4.48mmol) を加えて 室温で3時間攪拌した。その後、反応液を濾過し、減圧下濃縮したのち酢酸エチルで 希釈して、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシ ウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去して得られたアミン(332mg)を、テトラヒ ドロフラン (5 m L) に溶解し、無水酢酸 (4 2 μ L、0.445 m m o 1)、ギ酸 (2 5 μ L、0. 6 6 3 m m o 1) を加えて 6 0 ℃で 3 0 分間撹拌した後、室温で 1 時間 撹拌した。この溶液を減圧下濃縮し、酢酸エチルで希釈して、水、飽和炭酸水素ナト リウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留 去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン-酢酸エチル(2: 3) で溶出すると、目的化合物(202mg、収率:60%) が得られた。 IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3439, 228, 2856, 1749, 1694 cm⁻¹., ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (12H, t, J=6.6-7.3 Hz), 1.26-1.77 (76H, m), 2.01-2.02 (4H, m), 2.54 (2H, t, J=7.3 Hz), 3.19 (1H, d, J=4.4 Hz, OH), 3.21 (1H, m), 3.29-3.81 (13H, m, containing 2H, s, at 3.41 ppm), 3.85-3.90 (2H, m), 4.05-4.26 (6H, m), 4.31 (1H, dd, J=5.9, 11.7 Hz), 4.54-4.67 (8H, m), 4.80 (1H, d, J=3.7 Hz), 5.20 (1H, d, J=8.1

Hz), 5. 24-5. 39 (10H, m), 5. 85-5. 98 (4H, m), 6. 48 (0.75H, d, J=5.1 Hz, NH, trans), 7. 21 (1H, d, J=9.5 Hz, NH), 7. 25 (0.25H, d, J=7.3 Hz, NH, cis), 8. 08 (0.25H, d, J=11.0 Hz, CHO, cis), 8. 13 (0.75H, s, CHO, trans); MS (FAB, positive) m/z 1547 (M+K) $^+$; 1531 (M+Na) $^+$; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{82}H_{145}N_2O_{20}PNa$: 1532.0026; found: 1532.0035.

(参考例77)

参考例 74 の化合物(354 mg、0.214 mm o 1)のテトラヒドロフラン(3 mL)溶液に、酢酸(2 mL)、亜鉛粉末(280 mg、4.28 mm o 1)を加えて室温で 3 時間攪拌した。その後、反応液を濾過し、減圧下濃縮したのち酢酸エチルで希釈して、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去して得られたアミン(315 mg)を、テトラヒドロフラン(3 mL)、水(2 mL)に溶解し、ピリジン(50 μ L、0.618 mm o 1)、無水酢酸(60 μ L、0.636 mm o 1)を加えて、室温で 1 時間撹拌した。この溶液を酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヘキサン一酢酸エチル(2:3)で溶出すると目的化合物(236 mg、収率:72%)が得られた。

IR (CHCl₃ solution) ν_{max} 3453, 2928, 2856, 1749, 1714, 1675 cm⁻¹., ¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 0.88 (12H, t, J=6.6-7.3 Hz), 1.26-1.81 (76H, m), 1.98-2.02 (7H, m, containing 3H, s, at 2.01 ppm), 2.54 (2H, t, J=7.3 Hz), 3.12 (1H, m), 3.31-3.39 (4H, m), 3.41 (2H, s), 3.46 (1H, t, J=9.5-10.3 Hz), 3.53-3.85 (9H, m, containing 0H), 3.93 (1H, t, J=8.1, 10.3 Hz), 4.05 (1H, d, J=10.3 Hz), 4.13-4.26 (4H, m, containing 2H, s, at 4.18 ppm), 4.31 (1H, dd, J=5.9, 11.7 Hz), 4.53-4.66 (8H,

190

m), 4.80 (1H, d, J=3.7 Hz), 5.23-5.38 (11H, m), 5.84-5.98 (4H, m), 6.25 (1H, d, J=6.6 Hz, NH), 7.19 (1H, d, J=8.8 Hz, NH); MS (FAB, positive) m/z 1561 (M+K)⁺; 1545 (M+Na)⁺; 1523 (M+H)⁺; High Resolution MS (FAB, positive) m/z: calcd. for $C_{83}H_{147}N_2O_{20}PNa$: 1546.0183; found: 1546.0175. Anal. Calcd. for $C_{83}H_{147}N_2O_{20}P$ (1524.0): C, 65.41; H, 9.72; N, 1.84; P, 2.03. Found: C, 64.91; H, 9.12; N, 1.89; P, 1.99.

(参考例78)

参考例 7 5 の化合物(3 5 8 m g、0. 2 2 6 m m o 1)について、参考例 7 6 と同様の操作を行うことにより、目的化合物 1 9 1 m g(収率:5 9%)が得られた。 IR(CHCl₃ solution) ν_{max} 3439, 2928, 2856, 1752, 1693 cm⁻¹., ¹H-NMR(400 MHz,CDCl₃) $\delta\delta$:0.88(12H,t,J=6.6-7.3 Hz),1.26-1.81(76H,m),1.97-2.02(4H,m),2.54(2H,t,J=7.3 Hz),3.23(1H,d,J=4.4 Hz,OH),3.29-3.86(21H,m,containing 3H,s,at 3.38 ppm,2H,s,at 3.41 ppm),4.05(1H,dd,J=2.2,11.0 Hz),4.12-4.34(4H,m,containing 2H,s,at 4.19 ppm),4.54-4.66(6H,m),4.80(1H,d,J=3.7 Hz),5.12(1H,d,J=8.1 Hz),5.24-5.39(8H,m),5.85-5.99(3H,m),6.35(0.75H,d,J=7.3 Hz,NH,trans),7.18(1H,d,J=9.5 Hz,NH),7.24(0.25H,d,J=8.8 Hz,NH,cis),8.07(0.25H,d,J=11.7 Hz,CHO,cis),8.14(0.75H,d,J=1.5 Hz,CHO,trans);MS(FAB,positive)m/z:Calcd.for $C_{79}H_{143}N_2O_{18}P$ Na:1461.9971;found:1461.9982.Anal.Calcd.for $C_{79}H_{143}N_2O_{18}P$ (1440.0):C,65.89;H,10.01;N,1.95;P,2.15.Found:C,65.40;H,10.00;N,1.93;P,2.08.

(参考例79)

(アリルオキシカルボニル)メチル 6-O-[2-アセタミド-2-デオキシー4

191

 $-O-\Im P$ リルホスホノ $-6-O-\Im F$ ル-3-O-[(R)-3-[(Z)-7-F]トラデセニルオキシ]テトラデシル] $-\beta-D-\Im P$ ルコピラノシル] $-2-\Im P$ オキシー $3-O-\ddot P$ デシル $-2-(3-\Im P)$ フテカナミド) $-\alpha-D-\Im P$ ルコピラノシド

参考例75の化合物(256mg、0.161mmol)について、参考例77と同様の操作を行うことにより、目的化合物(172mg、収率:74%)が得られた。IR(CHCl $_3$ solution) ν_{max} 3452, 2928, 2856, 1753, 1714, 1676 cm $^{-1}$., 1 H-NMR(400 MHz,CDCl $_3$) δ :0.88(12H,t,J=6.6-7.3 Hz),1.26-1.78(76H,m),1.97-2.02(7H,m,containing 3H,s,at 2.02 ppm),2.54(2H,t,J=7.3 Hz),3.22(1H,m),3.33-3.48(10H,m,containing 3H,s,at 3.38 ppm,2H,s,at 3.40 ppm),3.55-3.90(11H,m,containing 0H),4.03(1H,dd,J=1.5,11.7 Hz),4.16(1H,dt,J=3.7,9.5 Hz),4.18(2H,s),4.26(1H,q,J=8.8 Hz),4.54-4.66(6H,m),4.80(1H,d,J=3.7 Hz),5.16(1H,d,J=8.1 Hz),5.24-5.39(8H,m),5.84-5.98(3H,m),6.13(1H,d,J=6.6 Hz,NH),7.16(1H,d,J=8.8 Hz,NH);MS(FAB,positive)m/z 1491(M+K)⁺;1475(M+Na)⁺;High Resolution MS(FAB,positive)m/z:calcd.for $C_{80}H_{145}N_2O_{18}P$ Na: 1476.0128;found: 1476.0167.Anal.Calcd.for $C_{80}H_{145}N_2O_{18}P$ (1454.0):C,66.08;H,10.05;N,1.93;P,2.13.Found: C,65.69;H,9.93;N,1.95;P,1.97.

(試験例1)

マクロファージ活性抑制試験(アンタゴニスト試験)

ヒト単球系細胞株U937をTPA 30ng/ml存在下、37 $^{\circ}$ C、72時間処理した 'TPA処理 U937 細胞'を用いて、in vitroでTNF α を産生させる。産生されるTNF α はジェンザイム (Genzyme) 社のELISA KIT により定量した。

評価方法は、西島らの方法(テトラヘドロン、第53巻 16041-16060頁(1997年)、 [Tetrahedron, Vol. 53, 16041-16060(1997)])に準じて行った。

30~ng/ml の LPS (リポポリサッカライド)刺激により、6~時間の間にTPA処理 U9 37細胞 $10^5~$ 個につき約300pg~のTNF α が産生される(標準産生量 : 100%とする)。

LPS 30 ng/ml存在下、実施例化合物の存在下でのTNF α の産生量を標準産生量の 5 0%に抑制する濃度を求め、 IC_{50} (nM) として表わした。

192

各化合物の細胞毒性については、実施例各化合物存在下での6時間後のTPA処理 U93 7細胞の細胞生存率 (Cell Viability) をMTT 法により測定し、各化合物とも少なくとも5,000 nMの濃度に至るまで細胞毒性を示さないことを確認した。

[表2] LPSアンタゴニスト活性

化合物	LPSアンタゴニスト活性(IC ₅₀ [nM])
実施例6の化合物 実施例7の化合物 実施例8の化合物	0. 080 0. 006 0. 005
実施例9の化合物	0. 007

[産業上の利用の可能性]

本発明のリピッドA1位カルボキシメチレン類縁体は、優れたマクロファージ活性 抑制作用を示し、抗炎症剤、抗自己免疫疾患剤、免疫抑制剤又は抗敗血症剤として有 用である。 193

請求の範囲

 一般式 (式中、

$$(HO)_{2}P-O'' OR^{4} OOH_{2}COOH$$

$$OOH_{2}COOH$$

$$OOH_{2}COOH$$

$$OOH_{2}COOH$$

$$OOH_{2}COOH$$

$$OOH_{2}COOH$$

 R^1 及び R^3 は、同一又は異なって、下記(置換基群 A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_1-C_{20} アルカノイル基、下記(置換基群 A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_3-C_{20} アルケノイル基又は下記(置換基群 A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_3-C_{20} アルキノイル基を示し、

 R^2 及び R^4 は、同一又は異なって、下記(置換基群 A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_1-C_{20} アルキル基、下記(置換基群 A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_2-C_{20} アルケニル基、下記(置換基群 A)から選択された一種以上の基で置換されていてもよい C_2-C_{20} アルキニル基を示し、

 R^5 は、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、オキソ基を有していてもよい C_1-C_6 アルコキシ基、オキソ基を有していてもよい C_2-C_6 アルケニルオキシ基又はオキソ基を有していてもよい C_2-C_6 アルキニルオキシ基を示し、

(置換基群A) は、ハロゲン原子、水酸基、オキソ基、オキソ基を有していてもよい C_1-C_{20} アルコキシ基、オキソ基を有していてもよい C_2-C_{20} アルケニルオキシ基、オキソ基を有していてもよい C_2-C_{20} アルキニルオキシ基、オキソ基を有していてもよい C_1-C_{20} アルカノイルオキシ基、オキソ基を有していてもよい C_3-C_2 0アルケノイルオキシ基及びオキソ基を有していてもよい C_3-C_{20} アルキノイルオキシ基からなる群である。)

で表される化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。

2. R^1 が、(置換基群 A)から選択された置換基を有してもよい $C_8 - C_{16}$ アルカノイル基である請求の範囲第1項に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエ

ステル。

- 3. R^1 が、無置換又は(置換基群 A)から選択された水酸基若しくはオキソ基を置換基として有する、 $C_{12}-C_{14}$ アルカノイル基である請求の範囲第 1 項に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 4. R¹が、無置換又は(置換基群 A)から選択された水酸基若しくはオキソ基を置換基として有する、ドデカノイル基又はテトラデカノイル基である請求の範囲第1項に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 5. R^2 が、(置換基群 A)から選択された置換基を有してもよい、 $C_8 C_{16}$ アルキル基である請求の範囲第1項乃至第4項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 6. R^2 が、無置換又は(置換基群 A)から選択された水酸基を置換基として有する、 $C_{10}-C_{14}$ アルキル基である請求の範囲第1項乃至第4項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 7. R²が、無置換又は(置換基群 A)から選択された水酸基を置換基として有する、 ドデシル基又はテトラデシル基である請求の範囲第1項乃至第4項のいずれか一項の 請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 8. R^3 が、無置換の $C_1 C_{16}$ アルカノイル基である請求の範囲第1項乃至第7項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 9. R^3 が、無置換の C_1-C_4 アルカノイル基である請求の範囲第1項乃至第7項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 10. R³が、ホルミル基又はアセチル基である請求の範囲第1項乃至第7項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 11. R^4 が、(置換基群A)から選択された置換基を有してもよい、 C_8-C_{16} アルキル基又は C_8-C_{16} アルケニル基である請求の範囲第1項乃至第10項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 12. R^4 が、(置換基群A)から選択された置換基を有してもよい、 C_8-C_{16} アルキル基である請求の範囲第1項乃至第10項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化

合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。

- 13. R^4 が、(置換基群A)から選択されたフッ素原子、水酸基、無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルコキシ基、無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルカノイルオキシ基又は無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルカノイルオキシ基又は無置換の $C_{12}-C_{14}$ アルケノイルオキシ基を置換基として有する、 $C_{10}-C_{14}$ アルキル基又は $C_{10}-C_{14}$ アルケニル基である請求の範囲第1項乃至第10項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 14. R^4 が、(置換基群 A)から選択されたフッ素原子、水酸基、無置換の C_{12} $-C_{14}$ アルコキシ基、無置換の C_{12} $-C_{14}$ アルカノイルオキシ基又は無置換の C_{12} $-C_{14}$ アルカノイルオキシ基又は無置換の C_{12} $-C_{14}$ アルカノイルオキシ基を置換基として有する、 C_{10} $-C_{14}$ アルキル基である請求の範囲第1項乃至第10項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 15. R^4 が、(置換基群A)から選択されたフッ素原子、水酸基、無置換の C_{12} $-C_{14}$ アルコキシ基又は無置換の C_{12} $-C_{14}$ アルカノイルオキシ基を置換基として有する、 C_{10} $-C_{14}$ アルキル基である請求の範囲第1項乃至第10項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 16. R^4 が、(置換基群 A)から選択されたフッ素原子、水酸基、無置換の C_{12} $-C_{14}$ アルケニルオキシ基又は無置換の C_{12} $-C_{14}$ アルケノイルオキシ基を置換基として有する、 C_{10} $-C_{14}$ アルキル基である請求の範囲第1項乃至第10項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 17. R^4 が、(置換基群 A)から選択されたフッ素原子、水酸基、無置換の C_{12} C_{14} アルコキシ基を置換基として有する、 C_{10} $-C_{14}$ アルキル基である請求の範囲第1項乃至第10項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 18. R^4 が、(置換基群 A)から選択されたフッ素原子、水酸基、無置換の C_{12} C_{14} アルケニルオキシ基を置換基として有する、 C_{10} $-C_{14}$ アルキル基である請求の範囲第1項乃至第10項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 19. R⁴が、(置換基群A)から選択されたドデシルオキシ基、テトラデシルオキ

WO 01/77133

シ基、5ードデセニルオキシ基、7ーテトラデセニルオキシ基、ドデカノイルオキシ 基、テトラデカノイルオキシ基、5ードデセノイルオキシ基又は7ーテトラデセノイ ルオキシ基を置換基として有する、ドデシル基又はテトラデシル基である請求の範囲 第1項乃至第10項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容し うる塩又はそのエステル。

- 20. R⁴が、(置換基群A)から選択されたドデシルオキシ基、テトラデシルオキシ基、ドデカノイルオキシ基又はテトラデカノイルオキシ基を置換基として有する、ドデシル基又はテトラデシル基である請求の範囲第1項乃至第10項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 21. R⁴が、(置換基群A)から選択された5-ドデセニルオキシ基、7-テトラデセニルオキシ基、5-ドデセノイルオキシ基又は7-テトラデセノイルオキシ基を置換基として有する、ドデシル基又はテトラデシル基である請求の範囲第1項乃至第10項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 22. R⁴が、(置換基群A)から選択されたドデシルオキシ基又はテトラデシルオキシ基を置換基として有する、ドデシル基又はテトラデシル基である請求の範囲第1項乃至第10項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 23. R⁴が、(置換基群A)から選択された5-ドデセニルオキシ基又は7-テトラデセニルオキシ基を置換基として有する、ドデシル基又はテトラデシル基である請求の範囲第1項乃至第10項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 24. R^5 が、ハロゲン原子、水酸基又は無置換の $C_1 C_6$ アルコキシ基である請求の範囲第1項乃至第23項のいずれか一項の請求の範囲に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 25. R⁵が、フッ素原子、水酸基又はメトキシ基である1乃至23のいずれか1項に記載の化合物その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。
- 26. カルボキシメチル 6 $-O-[2-rセタミド-2-デオキシ-3-O-\{(R)-3-ドデシルオキシテトラデシル} -6-O-メチル-4-O-ホスホノ-<math>\beta-D$

WO 01/77133

197

PCT/JP01/03005

カルボキシメチル $6-O-[2-Pセタミド-2, 6-ジデオキシ-3-O-\{(R)-3-ドデシルオキシテトラデシル}-6-フルオロー4-O-ホスホノー<math>\beta$ -D-グルコピラノシル] $-2-デオキシ-2-\{(R)-3-ヒドロキシテトラデカナミド\}-3-O-\{(R)-3-ヒドロキシテトラデシル\}-\alpha-D-グルコピラノシド、$

カルボキシメチル 3-O-デシルー2-デオキシー6-O-[2-デオキシー3-O-[(R)-3-メトキシデシル]-2-[(Z)-11-オクタデセナミド]-4-O-ホスホノー $\beta-D-$ グルコピラノシル]-2-(3-オキソテトラデカナミド) $-\alpha-D-$ グルコピラノシド、

カルボキシメチル $3-O-\overline{r}シル-2-\overline{r}オキシ-6-O-[2-\overline{r}オキシ-3$ $-O-[(R)-3-メトキシデシル]-6-O-メチル-2-[(Z)-11-オクタ デセナミド]-4-O-ホスホノ-<math>\beta$ -D-グルコピラノシル]-2-(3-オキソテトラデカナミド)- α -D-グルコピラノシド、

カルボキシメチル 6-O-[2-デオキシ-2-ホルムアミド-4-O-ホスホ $<math>J-3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]テトラデシル]-\beta$ $-D-グルコピラノシル]-2-デオキシ-3-O-ドデシル-2-(3-オキソテトラデカナミド) <math>-\alpha-D-グルコピラノシド$ 、

カルボキシメチル $6-O-[2-Pセタミド-2-デオキシ-4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]テトラデシル]-<math>\beta$ -D-グルコピラノシル]-2-デオキシ-3-O-ドデシル-2-(3-オキソテトラデカナミド)- α -D-グルコピラノシド、

カルボキシメチル 6-O-[2-デオキシ-2-ホルムアミド-6-O-メチル-4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]

テトラデシル] $-\beta$ - D - - D

198

カルボキシメチル $6-O-[2-Pセタミド-2-デオキシ-6-O-メチルー4-O-ホスホノ-3-O-[(R)-3-[(Z)-7-テトラデセニルオキシ]テトラデシル]-<math>\beta-D-$ グルコピラノシル]-2-デオキシ-3-O-ドデシルー2-(3-オキソテトラデカナミド) $-\alpha-D-$ グルコピラノシド、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル。

- 27. 請求の範囲第1項に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル を有効成分として含有する医薬。
- 28. 請求の範囲第1項に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル を有効成分として含有する、炎症の予防剤又は治療剤。
- 29. 請求の範囲第1項に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル を有効成分として含有する、自己免疫疾患の予防剤又は治療剤。
- 30. 請求の範囲第1項に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル を有効成分として含有する、敗血症の予防剤又は治療剤。
- 31. 請求の範囲第1項に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステル を有効成分として含有する、免疫抑制剤。
- 32. 請求の範囲第1項の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステルの有効量を炎症の哺乳動物に投与する治療又は予防方法。
- 33. 請求の範囲第1項の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステルの有効量を自己免疫疾患の哺乳動物に投与する治療又は予防方法。
- 34. 請求の範囲第1項の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステルの有効量を敗血症の哺乳動物に投与する治療又は予防方法。
- 3 5. 請求の範囲第1項の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステルの有効量を哺乳動物に投与する免疫抑制方法。
- 36. 炎症の予防又は治療のための、請求の範囲第1項に記載の化合物、その薬理上 許容しうる塩又はそのエステルの使用。
- 37. 自己免疫疾患の予防又は治療のための、請求の範囲第1項に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステルの使用。

199

- 38. 敗血症の予防又は治療のための、請求の範囲第1項に記載の化合物、その薬理上許容しうる塩又はそのエステルの使用。
- 39. 免疫抑制のための、請求の範囲第1項に記載の化合物、その薬理上許容しうる 塩又はそのエステルの使用。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/03005

A. CLASS	SIFICATION OF SUBJECT MATTER		
	Cl ⁷ C07H15/04, A61K31/7028, A6	31P29/00, 37/06, 31/04	
	o International Patent Classification (IPC) or to both na	tional classification and IPC	
	S SEARCHED		
	ocumentation searched (classification system followed		
Int.	Cl ⁷ C07H15/04, A61K31/7028, A6	31P29/00, 37/06, 31/04	
Dogumentat	ion searched other than minimum documentation to the		- the fields searched
Documentat	ion searched other than minimum documentation to the	e extent that such documents are included	in the neids scarched
	ata base consulted during the international search (nam		rch terms used)
KEGI	STRY(STN), CAPLUS(STN), CAOLD(STN)	
C. DOCU	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where ap	ista of the relevant passages	Relevant to claim No.
	•		
х	JP, 63-183594, A (Daiichi Pharm 28 July, 1988 (28.07.88) (Fam		1-5,8-12,24,25
Y	20 July, 1988 (20.07.88)	ily: none,	6,7,13-23,30
A	Full ceae		26,28,29,31
Y	EP, 536969, A2 (Eisai Co., Ltd.	.),	6,7,13-23,30
A	14 April, 1993 (14.04.93)		26,28,29,31
	& JP, 5-194470, A & US, 55301	113, A	
	& AU, 9225266, AI & CA, 20/93	971, AA	
	& AU, 9225266, A1 & CA, 20799 & ZA, 9207751, A & NO, 92039 & HU, 64538, A2 & RU, 20953	366 C1	
	& CN, 1071666, A & US, 56124	476. A	
	& US, 5756718, A & US, 58439	918, A	
	Full text		
	1.		
	<u>'</u> };		
Further	r documents are listed in the continuation of Box C.	See patent family annex.	
	categories of cited documents:	"T" later document published after the inte	
conside	ent defining the general state of the art which is not red to be of particular relevance	priority date and not in conflict with the understand the principle or theory und	ϵ the invention
	document but published on or after the international filing	"X" document of particular relevance; the considered poyel or cappet be considered.	
date "L" docume	ent which may throw doubts on priority claim(s) or which is	considered novel or cannot be conside step when the document is taken alone	
cited to	establish the publication date of another citation or other	"Y" document of particular relevance; the	claimed invention cannot be
	reason (as specified) ent referring to an oral disclosure, use, exhibition or other	considered to involve an inventive step combined with one or more other such	
means		combination being obvious to a person	skilled in the art
	ent published prior to the international filing date but later priority date claimed	"&" document member of the same patent	amily
	actual completion of the international search	Date of mailing of the international sear	rch report
18 June, 2001 (18.06.01)		26 June, 2001 (26.06	
	·		
Marca and m	allian addings of the ICA/	Authorized officer	
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office		Authorized officer	
Japanese racent Office			
Facsimile No.		Telephone No.	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/03005

	_	Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)
This	inte	ernational search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:
i		
1.	\boxtimes	Claims Nos.: 32-39 because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
	CI	aims 32-39 pertain to methods for treatment of the human body by therapy, and
l i	th	ous relate to subject matters which this International Searching Authority is required to search.
2.		Claims Nos.: because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3.		Claims Nos.:
		because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).
Box		Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)
This	Inte	emational Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:
_		
1. [As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. [As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. [As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
		}
	_,	
4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:		
		, and the state of
Rem	ark	on Protest The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
		No protest accompanied the payment of additional search fees.

A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC))

Int. Cl⁷ C07H15/04, A61K31/7028, A61P29/00, 37/06, 31/04

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))

Int. Cl⁷ C07H15/04, A61K31/7028, A61P29/00, 37/06, 31/04

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語)

REGISTRY (STN), CAPLUS (STN), CAOLD (STN)

C. 関連すると認められる文献				
引用文献の		関連する		
カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	請求の範囲の番号		
X	JP, 63-183594, A(第一製薬株式会社)28.7月.1988(28.07.88)	1-5, 8-12, 24,		
	(ファミリーなし)	25, 27		
Y	全文参照。	6, 7, 13-23, 30		
A		26, 28, 29, 31		
Y	EP,536969,A2 (Eisai Co.,Ltd.) 14.4月.1993(14.04.93)	6, 7, 13-23, 30		
Α	& JP, 5-194470, A&US, 5530113, A&AU, 9225266, A1&CA, 2079971, AA	26, 28, 29, 31		
	&ZA, 9207751, A&NO, 9203939, A&HU, 64538, A2&RU, 2095366, C1			
	&CN, 1071666, A&US, 5612476, A&US, 5756718, A&US, 5843918, A			
	全文参照。	,		
□ C堋の练さによ立前が列送されている □ パテントファミリーに関する別紙を参照				

□ C欄の続きにも文献が列挙されている。

□ パテントファミリーに関する別紙を参照。

- * 引用文献のカテゴリー
- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示す
- 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日 以後に公表されたもの
- 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行 日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する 文献(理由を付す)
- 「O」ロ頭による開示、使用、展示等に言及する文献
- 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

- の日の後に公表された文献
- 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって 出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論 の理解のために引用するもの
- 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明 の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
- 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以 上の文献との、当業者にとって自明である組合せに よって進歩性がないと考えられるもの
- 「&」同一パテントファミリー文献

第 I 欄 法第83 成しなか	請求の範囲の一部の調査ができないときの意見(第1ページの2の続き) 条第3項 (PCT17条(2)(a)) の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作いった。	
1. X	請求の範囲 <u>32-39</u> は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。 つまり、	
	請求の範囲32-39は、治療による人体の処置方法に関するものであって、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。	
2.	請求の範囲 は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、	
3. 🗌	請求の範囲は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に 従って記載されていない。	
第Ⅱ欄	発明の単一性が欠如しているときの意見(第1ページの3の続き)	
次に対	☆べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。	
1.	出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求 の範囲について作成した。	
2.	追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追 加調査手数料の納付を求めなかった。	
3.	出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。	
4.	出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。	
追加調査	を手数料の異議の申立てに関する注意] 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。] 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。	